

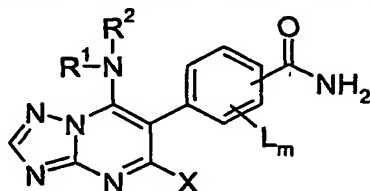
LAP20Rec'd PCT/PTO 25 MAY 2006

6-(Aminocarbonyl-phenyl)-Triazolopyrimidine, Verfahren zu ihrer Herstellung und ihre Verwendung zur Bekämpfung von Schadpilzen sowie sie enthaltende Mittel

# Beschreibung

5

Die vorliegende Erfindung betrifft substituierte Triazolopyrimidine der Formel I



in der die Substituenten folgende Bedeutung haben:

- 10  $R^1, R^2$  unabhängig voneinander Wasserstoff,  $C_1$ - $C_8$ -Alkyl,  $C_1$ - $C_8$ -Halogenalkyl,  $C_3$ - $C_8$ -Cycloalkyl,  $C_3$ - $C_8$ -Halogenocycloalkyl,  $C_2$ - $C_8$ -Alkenyl,  $C_2$ - $C_8$ -Halogenalkenyl,  $C_3$ - $C_8$ -Cycloalkenyl,  $C_3$ - $C_8$ -Halogenocycloalkenyl,  $C_2$ - $C_8$ -Alkynyl,  $C_2$ - $C_8$ -Halogenalkynyl oder Phenyl, Naphthyl, oder ein fünf- oder sechsgliedriger gesättigter, partiell un-
- 15 gesättigter oder aromatischer Heterocyclus, enthaltend ein bis vier Heteroatome aus der Gruppe O, N oder S,

- $R^1$  und  $R^2$  können auch zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, ein fünf- oder sechsgliedriges Heterocyclyl oder Heteroaryl bilden, welches über N gebunden ist und ein bis drei weitere Heteroatome aus der Gruppe O, N
- 20 und S als Ringglied enthalten und/oder einen oder mehrere Substituenten aus der Gruppe Halogen,  $C_1$ - $C_8$ -Alkyl,  $C_1$ - $C_8$ -Halogenalkyl,  $C_2$ - $C_8$ -Alkenyl,  $C_2$ - $C_8$ -Halogenalkenyl,  $C_1$ - $C_6$ -Alkoxy,  $C_1$ - $C_6$ -Halogenalkoxy,  $C_3$ - $C_6$ -Alkenyloxy,  $C_3$ - $C_6$ -Halogenalkenyloxy, (exo)- $C_1$ - $C_6$ -Alkylen und Oxy- $C_1$ - $C_3$ -alkylenoxy tragen kann;

- 25  $R^1$  und/oder  $R^2$  können eine bis vier gleiche oder verschiedene Gruppen  $R^a$  tragen:

- $R^a$  Halogen, Cyano, Nitro, Hydroxy,  $C_1$ - $C_6$ -Alkyl,  $C_1$ - $C_6$ -Halogenalkyl,  $C_1$ - $C_6$ -Alkylcarbonyl,  $C_3$ - $C_6$ -Cycloalkyl,  $C_1$ - $C_6$ -Alkoxy,  $C_1$ - $C_6$ -Halogenalkoxy,  $C_1$ - $C_6$ -Alkoxy-
- 30 Alkylthio,  $C_1$ - $C_6$ -Alkylamino, Di- $C_1$ - $C_6$ -alkylamino,  $C_2$ - $C_8$ -Alkenyl,  $C_2$ - $C_8$ -Halogenalkenyl,  $C_3$ - $C_8$ -Cycloalkenyl,  $C_2$ - $C_6$ -Alkenyloxy,  $C_3$ - $C_6$ -Halogenalkenyloxy,  $C_2$ - $C_6$ -Alkynyl,  $C_2$ - $C_6$ -Halogenalkynyl,  $C_3$ - $C_6$ -Alkinyloxy,  $C_3$ - $C_6$ -Halogenalkinyloxy,  $C_3$ - $C_6$ -Cycloalkoxy,  $C_3$ - $C_6$ -Cycloalkenyloxy, Oxy- $C_1$ - $C_3$ -alkylenoxy, Phenyl, Naphthyl, fünf- bis zehngliedriger gesättigter, partiell ungesättigter oder aromatischer Heterocyclus, ent-
- 35 haltend ein bis vier Heteroatome aus der Gruppe O, N oder S,

## 2

wobei diese aliphatischen, alicyclischen oder aromatischen Gruppen ihrerseits partiell oder vollständig halogeniert sein oder eine bis drei Gruppen R<sup>b</sup> tragen können:

- 5                    R<sup>b</sup>    Halogen, Cyano, Nitro, Hydroxy, Mercapto, Amino, Carboxyl, Amino-carbonyl, Aminothiocarbonyl, Alkyl, Haloalkyl, Alkenyl, Alkenyloxy, Alkinyloxy, Alkoxy, Halogenalkoxy, Alkylthio, Alkylamino, Dialkylamino, Formyl, Alkylcarbonyl, Alkylsulfonyl, Alkylsulfoxyl, Alkoxy-carbonyl, Alkylcarbonyloxy, Alkylaminocarbonyl, Dialkylaminocarbonyl, Alkylaminothiocarbonyl, Dialkylaminothiocarbonyl, wobei die Alkylgruppen in diesen Resten 1 bis 6 Kohlenstoffatome enthalten und die genannten Alkenyl- oder Alkinylgruppen in diesen Resten 2 bis 8 Kohlenstoffatome enthalten;
- 10
- 15                    und/oder einen bis drei der folgenden Reste:
- Cycloalkyl, Cycloalkoxy, Heterocyclyl, Heterocyclyloxy, wobei die cyclischen Systeme 3 bis 10 Ringglieder enthalten; Aryl, Aryloxy, Arylthio, Aryl-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkoxy, Aryl-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl, Hetaryl, Hetaryloxy, Hetarylthio, wobei die Arylreste vorzugsweise 6 bis 10 Ringglieder, die Hetarylreste 5 oder 6 Ringglieder enthalten, wobei die cyclischen Systeme partiell oder vollständig halogeniert oder durch Alkyl- oder Haloalkylgruppen substituiert sein können.
- 20
- 25    L    Halogen, Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyloxy oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy-carbonyl;
- m    1, 2, 3 oder 4, wobei die Gruppen L verschieden sein können wenn m größer als 1 ist;
- 30    X    Halogen, Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy oder C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-Halo-genalkoxy.

- 35                    Außerdem betrifft die Erfindung Verfahren und Zwischenprodukte zur Herstellung dieser Verbindungen, sie enthaltende Mittel sowie ihre Verwendung zur Bekämpfung von pflanzenpathogenen Schadpilzen.

Aus EP-A 71 792, EP-A 550 113 sind 5-Chlor-6-phenyl-7-amino-triazolopyrimidine allgemein bekannt. In WO 03/080615 werden 6-Phenyl-Triazolopyrimidine allgemein vor-

## 3

geschlagen, deren Phenylgruppe in para-Stellung eine Alkylamid-Gruppe tragen kann. Diese Verbindungen sind zur Bekämpfung von Schadpilzen bekannt.

Die erfindungsgemäßen Verbindungen unterscheiden sich von den in WO 03/080615 beschriebenen durch die Carbonsäureamid-Gruppe als Substituent des 6-Phenyl-

5 ringes.

Die Wirkung der bekannten Verbindungen ist jedoch in vielen Fällen nicht zufriedenstellend. Davon ausgehend, liegt der vorliegenden Erfindung die Aufgabe zugrunde, Verbindungen mit verbesserter Wirkung und/oder verbreitertem Wirkungsspektrum bereitzustellen.

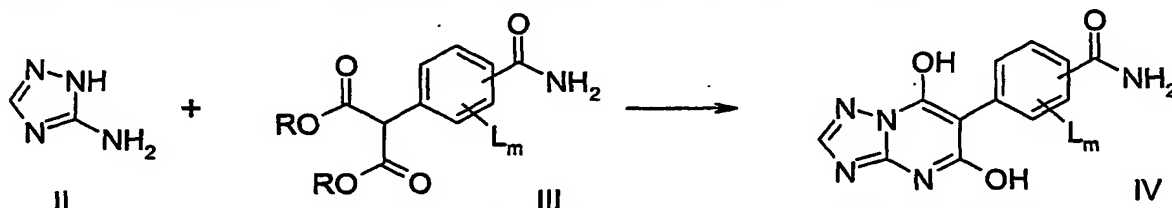
10

Demgemäss wurden die eingangs definierten Verbindungen gefunden. Des weiteren wurden Verfahren und Zwischenprodukte zu ihrer Herstellung, sie enthaltende Mittel sowie Verfahren zur Bekämpfung von Schadpilzen unter Verwendung der Verbindungen I gefunden.

15

Die erfindungsgemäßen Verbindungen können auf verschiedenen Wegen erhalten werden. Vorteilhaft werden sie durch Umsetzung von 5-Aminotriazol der Formel II mit entsprechend substituierten Phenylmalonaten der Formel III, in der R für Alkyl, bevorzugt für C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, insbesondere für Methyl oder Ethyl steht, dargestellt.

20



Diese Umsetzung erfolgt üblicherweise bei Temperaturen von 80°C bis 250°C, vorzugsweise 120°C bis 180°C, ohne Solvens oder in einem inerten organischen Lösungsmittel in Gegenwart einer Base [vgl. EP-A 770 615] oder in Gegenwart von Essigsäure unter den aus Adv. Het. Chem. Bd. 57, S. 81ff. (1993) bekannten Bedingungen.

25

Geeignete Lösungsmittel sind aliphatische Kohlenwasserstoffe, aromatische Kohlenwasserstoffe wie Toluol, o-, m- und p-Xylol, halogenierte Kohlenwasserstoffe, Ether, Nitrile, Ketone, Alkohole, sowie N-Methylpyrrolidon, Dimethylsulfoxid, Dimethylformamid und Dimethylacetamid. Besonders bevorzugt wird die Umsetzung ohne Lösungsmittel oder in Chlorbenzol, Xylol, Dimethylsulfoxid, N-Methylpyrrolidon durchgeführt. Es können auch Gemische der genannten Lösungsmittel verwendet werden.

30

35

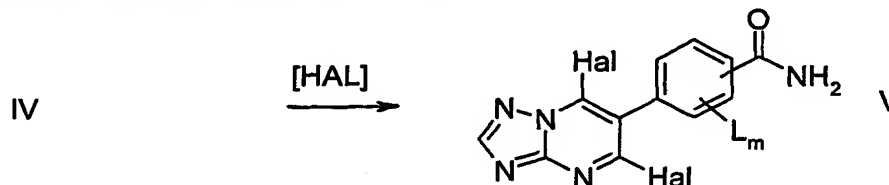
Als Basen kommen allgemein anorganische Verbindungen wie Alkalimetall- und Erdalkalimetallhydroxide, Alkalimetall- und Erdalkalimetalloxide, Alkalimetall- und Erdalkalimetallhydride, Alkalimetallamide, Alkalimetall- und Erdalkalimetallcarbonate sowie Alkalimetallalkyle, Alkylmagnesiumhalogenide sowie Alkalimetall- und Erdalkalimetallalkoholate und Dimethoxymagnesium, außerdem organische Basen, z.B. tertiäre Amine wie Trimethylamin, Triethylamin, Tri-isopropylethylamin, Tributylamin und N-Methylpiperidin, N-Methylmorpholin, Pyridin, substituierte Pyridine wie Collidin, Lutidin und 4-Dimethylaminopyridin sowie bicyclische Amine in Betracht. Besonders bevorzugt werden tertiäre Amine wie Tri-isopropylethylamin, Tributylamin, N-Methylmorpholin oder N-Methylpiperidin.

Die Basen werden im allgemeinen in katalytischen Mengen eingesetzt, sie können aber auch äquimolar, im Überschuss oder gegebenenfalls als Lösungsmittel verwendet werden.

Die Edukte werden im allgemeinen in äquimolaren Mengen miteinander umgesetzt. Es kann für die Ausbeute vorteilhaft sein, die Base und das Malonat III in einem Überschuss bezogen auf das Triazol einzusetzen.

Phenylmalonate der Formel III werden vorteilhaft aus der Reaktion entsprechend substituierter Brombenzole mit Dialkylmalonaten unter Cu(I)-Katalyse erhalten [vgl. Chemistry Letters, S. 367-370, 1981; EP-A 10 02 788].

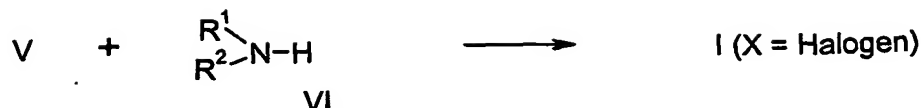
Die Dihydroxytriazolopyrimidine der Formel IV werden unter den aus WO-A 94/20501 bekannten Bedingungen in die Dihalogenpyrimidine der Formel V überführt, in der Hal ein Halogenatom, bevorzugt ein Brom oder ein Chloratom, insbesondere ein Chloratom bedeutet. Als Halogenierungsmittel [HAL] wird vorteilhaft ein Chlorierungsmittel oder ein Bromierungsmittel, wie Phosphoroxybromid oder Phosphoroxychlorid, ggf. in Anwesenheit eines Lösungsmittels, eingesetzt.



Diese Umsetzung wird üblicherweise bei 0°C bis 150°C, bevorzugt bei 80°C bis 125°C, durchgeführt [vgl. EP-A 770 615].

Dihalogenpyrimidine der Formel V werden mit Aminen der Formel VI,

5



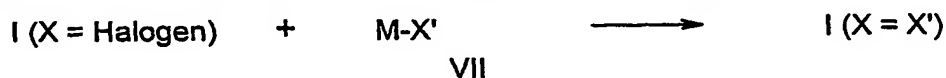
in der  $R^1$  und  $R^2$  wie in Formel I definiert sind, zu Verbindungen der Formel I, in der X für Halogen steht, weiter umgesetzt.

- 5 Diese Umsetzung wird vorteilhaft bei 0°C bis 70°C, bevorzugt 10°C bis 35°C durchgeführt, vorzugsweise in Anwesenheit eines inerten Lösungsmittels, wie Ether, z. B. Dioxan, Diethylether oder insbesondere Tetrahydrofuran, halogenierte Kohlenwasserstoffe, wie Dichlormethan und aromatische Kohlenwasserstoffe, wie beispielsweise Toluol [vgl. WO-A 98/46608].

10

Die Verwendung einer Base, wie tertiäre Amine, beispielsweise Triethylamin oder anorganische Basen, wie Kaliumcarbonat ist bevorzugt; auch überschüssiges Amin der Formel VI kann als Base dienen.

- 15 Verbindungen der Formel I, in der X Cyano,  $C_1$ - $C_8$ -Alkoxy oder  $C_1$ - $C_2$ -Halogenalkoxy bedeutet, können vorteilhaft aus der Umsetzung von Verbindungen I, in der X Halogen, bevorzugt Chlor bedeutet, mit Verbindungen  $M-X'$  (Formel VII) erhalten werden. Verbindungen VII stellen je nach der Bedeutung der einzuführenden Gruppe  $X'$  ein anorganisches Cyanid, ein Alkoxylat oder ein Halogenalkoxylat dar. Die Umsetzung erfolgt
- 20 vorteilhaft in Anwesenheit eines inerten Lösungsmittels. Das Kation M in Formel VII hat geringe Bedeutung; aus praktischen Gründen sind üblicherweise Ammonium-, Tetraalkylammonium- oder Alkali- oder Erdalkalimetallsalze bevorzugt.



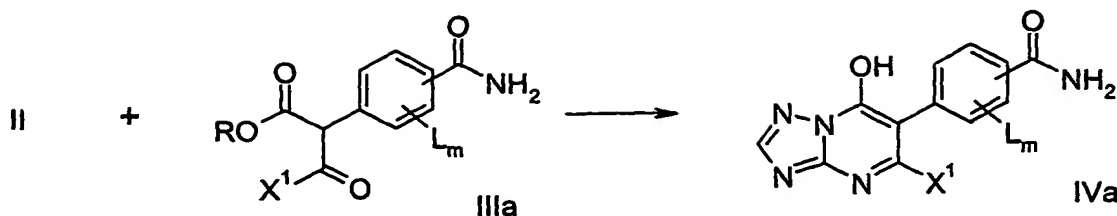
- 25 Üblicherweise liegt die Reaktionstemperatur bei 0 bis 120°C, bevorzugt bei 10 bis 40°C [vgl. J. Heterocycl. Chem., Bd.12, S. 861-863 (1975)].

Geeignete Lösungsmittel umfassen Ether, wie Dioxan, Diethylether und, bevorzugt Tetrahydrofuran, halogenierte Kohlenwasserstoffe wie Dichlormethan und aromatische Kohlenwasserstoffe, wie Toluol.

30

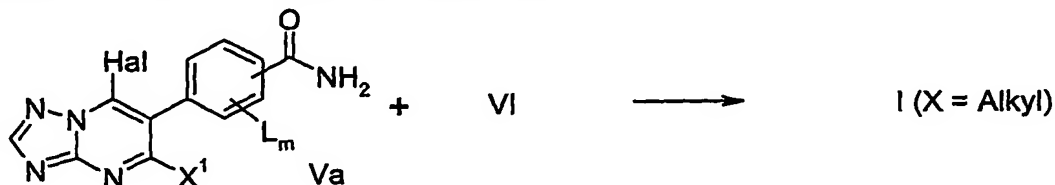
Verbindungen der Formel I, in denen X für  $C_1$ - $C_4$ -Alkyl oder  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkyl steht, können vorteilhaft durch folgenden Syntheseweg erhalten werden:

6



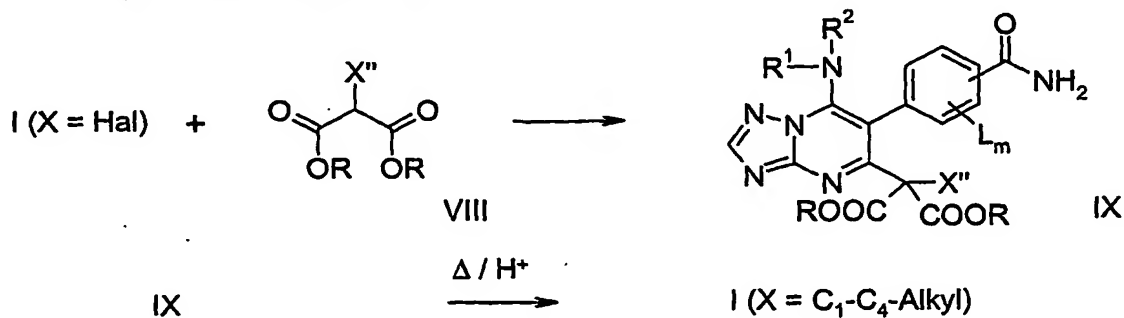
Ausgehend von den Ketoestern IIIa werden die 5-Alkyl-7-hydroxy-6-phenyltriazolopyrimidine IVa erhalten. In Formeln IIIa und IVa steht X<sup>1</sup> für C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl. Durch Verwendung der leicht zugänglichen 2-Phenylacetessigestern (IIIa mit X<sup>1</sup>=CH<sub>3</sub>) werden die 5-Methyl-7-hydroxy-6-phenyltriazolopyrimidine erhalten [vgl. Chem. Pharm. Bull., 9, 801, (1961)]. Die Herstellung der Ausgangsverbindungen IIIa erfolgt vorteilhaft unter den aus EP-A 10 02 788 beschriebenen Bedingungen.

- Die so erhaltenen 5-Alkyl-7-hydroxy-6-phenyltriazolopyrimidine werden mit Halogenierungsmitteln [HAL] unter den weiter oben beschriebenen Bedingungen zu den 7-Halogenotriazolopyrimidinen der Formel Va umgesetzt. Bevorzugt werden Chlorierungs- oder Bromierungsmittel wie Phosphoroxybromid, Phosphoroxychlorid, Thionylchlorid, Thionylbromid oder Sulfurylchlorid eingesetzt. Die Umsetzung kann in Substanz oder in Gegenwart eines Lösungsmittels durchgeführt werden. Übliche Reaktionstemperaturen betragen von 0 bis 150°C oder vorzugsweise von 80 bis 125°C.



Die Umsetzung von Va mit Aminen VI erfolgt unter den weiter oben beschriebenen Bedingungen.

- Verbindungen der Formel I in der X C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl bedeutet, können alternativ auch aus Verbindungen I, in der X Halogen, insbesondere Chlor, bedeutet und Malonaten der Formel VIII hergestellt werden. In Formel VIII bedeuten X'' Wasserstoff oder C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-Alkyl und R C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl. Sie werden zu Verbindungen der Formel IX umgesetzt und zu Verbindungen I decarboxyliert [vgl. US 5,994,360].



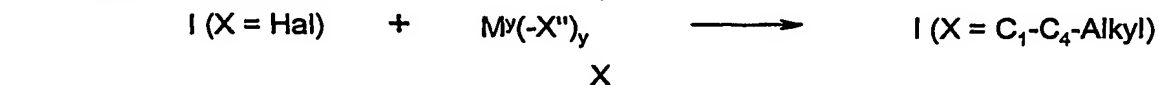
25

Die Malonate VIII sind in der Literatur bekannt [J. Am. Chem. Soc., Bd. 64, 2714 (1942); J. Org. Chem., Bd. 39, 2172 (1974); Helv. Chim. Acta, Bd. 61, 1565 (1978)] oder können gemäß der zitierten Literatur hergestellt werden.

- 5 Die anschließende Verseifung des Esters IX erfolgt unter allgemein üblichen Bedingungen, in Abhängigkeit der verschiedenen Strukturelemente kann die alkalische oder die saure Verseifung der Verbindungen IX vorteilhaft sein. Unter den Bedingungen der Esterverseifung kann die Decarboxylierung zu I bereits ganz oder teilweise erfolgen.
- 10 Die Decarboxylierung erfolgt üblicherweise bei Temperaturen von 20°C bis 180°C, vorzugsweise 50°C bis 120°C, in einem inerten Lösungsmittel, gegebenenfalls in Gegenwart einer Säure.

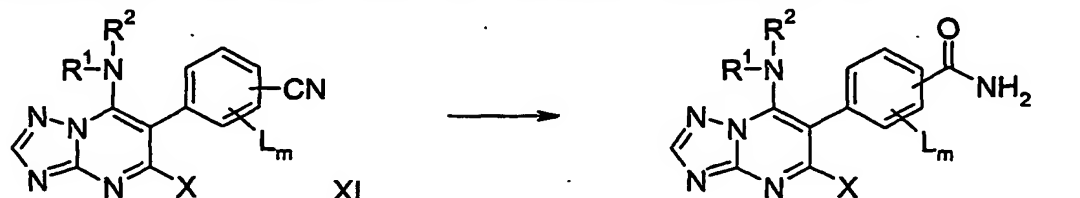
- Geeignete Säuren sind Salzsäure, Schwefelsäure, Phosphorsäure, Ameisensäure, Essigsäure, p-Toluolsulfonsäure. Geeignete Lösungsmittel sind Wasser, aliphatische Kohlenwasserstoffe wie Pentan, Hexan, Cyclohexan und Petrolether, aromatische Kohlenwasserstoffe wie Toluol, o-, m- und p-Xylol, halogenierte Kohlenwasserstoffe wie Methylenchlorid, Chloroform und Chlorbenzol, Ether wie Diethylether, Diisopropylether, tert.-Butylmethylether, Dioxan, Anisol und Tetrahydrofuran, Nitrile wie Acetonitril und Propionitril, Ketone wie Aceton, Methylethylketon, Diethylketon und tert.-Butylmethylether, Alkohole wie Methanol, Ethanol, n-Propanol, Isopropanol, n-Butanol und tert.-Butanol, sowie Dimethylsulfoxid, Dimethylformamid und Dimethylacetamid, besonders bevorzugt wird die Reaktion in Salzsäure oder Essigsäure durchgeführt. Es können auch Gemische der genannten Lösungsmittel verwendet werden.

- 25 Verbindungen der Formel I, in denen X für C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl steht, können auch durch Kuppelung von 5-Halogentriazolopyrimidinen der Formel I, in der X Halogen bedeutet, mit metallorganischen Reagenzien der Formel X erhalten werden. In einer Ausführungsform dieses Verfahrens erfolgt die Umsetzung unter Übergangsmetallkatalyse, wie Ni- oder Pd-Katalyse.



- In Formel X steht M für ein Metallion der Wertigkeit Y, wie beispielsweise B, Zn oder Sn und X'' für C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-Alkyl. Diese Reaktion kann beispielsweise analog folgender Methoden durchgeführt werden: J. Chem. Soc. Perkin Trans. 1, 1187 (1994), ebenda 1, 2345 (1996); WO-A 99/41255; Aust. J. Chem., Bd. 43, 733 (1990); J. Org. Chem., Bd. 43, 358 (1978); J. Chem. Soc. Chem. Commun. 866 (1979); Tetrahedron Lett., Bd. 34, 8267 (1993); ebenda, Bd. 33, 413 (1992).
- 35

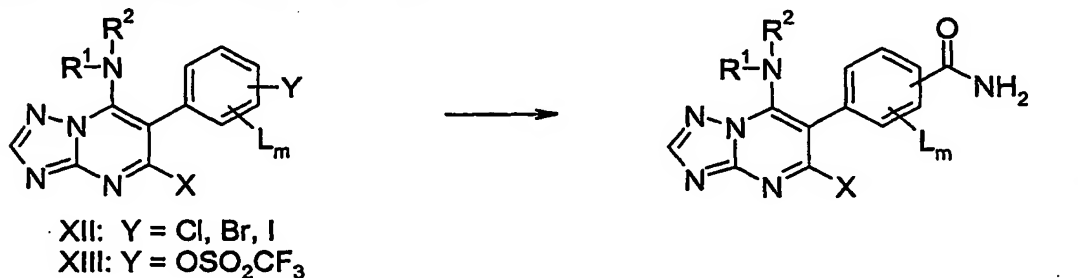
Verbindungen der Formel I können alternativ auch ausgehend von substituierten 6-Cyanophenyl-Triazolopyrimidinen der Formel XI hergestellt werden.



- 5 Diese Umsetzung kann in Anwesenheit von Schwefelsäure bei 0 bis 60°C, insbesondere 20 bis 25°C erfolgen [vgl. Synthetic Commun., 1999, S. 547ff.], alternativ kann die Umsetzung in dem Polyethylenglycol / NaOH – System bei 0 bis 60°C, insbesondere 20 bis 25°C in Anwesenheit eines Lösungs- oder Verdünnungsmittels erfolgen [vgl. Synthetic Commun., 2000, S. 1713ff.], oder mit Harnstoff / Wasserstoffperoxid bei 0 bis 60°C, insbesondere 20 bis 25°C in Anwesenheit eines Lösungs- oder Verdünnungsmittels erfolgen [vgl. Org. Lett. 1999, S. 189ff.].
- 10

Verbindungen der Formel XI sind aus WO 03/080615 bekannt, bzw. können gemäß der zitierten Literatur hergestellt werden.

- 15 Außerdem können die Verbindungen der Formel I durch Pd-katalysierte Aminocarbonylierung [vgl.: Tetrahedron Lett. Bd. 39, 2835-2838 (1998); J. Org. Chem. Bd. 66, 4311 ff (2001); WO 00/37428; DE 35 25 564; J. Org. Chem. Bd. 62, 8640-8653 (1997); JP 2000191612) der entsprechenden Halogenverbindungen XII [vgl. EP-A 550113] oder Triflate XIII hergestellt werden.



20

- Die Reaktionsgemische werden in üblicher Weise aufgearbeitet, z.B. durch Mischen mit Wasser, Trennung der Phasen und gegebenenfalls chromatographische Reinigung der Rohprodukte. Die Zwischen- und Endprodukte fallen z.T. in Form farbloser oder schwach bräunlicher, zäher Öle an, die unter vermindertem Druck und bei mäßig erhöhter Temperatur von flüchtigen Anteilen befreit oder gereinigt werden. Sofern die Zwischen- und Endprodukte als Feststoffe erhalten werden, kann die Reinigung auch durch Umkristallisieren oder Digerieren erfolgen.
- 25

Sofern einzelne Verbindungen I nicht auf den voranstehend beschriebenen Wegen zugänglich sind, können sie durch Derivatisierung anderer Verbindungen I hergestellt werden.

- 5    Sofern bei der Synthese Isomerengemische anfallen, ist im allgemeinen jedoch eine Trennung nicht unbedingt erforderlich, da sich die einzelnen Isomere teilweise während der Aufbereitung für die Anwendung oder bei der Anwendung (z.B. unter Licht-, Säure- oder Baseneinwirkung) ineinander umwandeln können. Entsprechende Umwandlungen können auch nach der Anwendung, beispielsweise bei der Behandlung von Pflanzen in  
10 der behandelten Pflanze oder im zu bekämpfenden Schadpilz erfolgen.

Bei den in den vorstehenden Formeln angegebenen Definitionen der Symbole wurden Sammelbegriffe verwendet, die allgemein repräsentativ für die folgenden Substituenten stehen:

15

Halogen: Fluor, Chlor, Brom und Jod;

- Alkyl: gesättigte, geradkettige oder verzweigte Kohlenwasserstoffreste mit 1 bis 4, 6 oder 8 Kohlenstoffatomen, z.B. C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl wie Methyl, Ethyl, Propyl, 1-Methylethyl,  
20 Butyl, 1-Methyl-propyl, 2-Methylpropyl, 1,1-Dimethylethyl, Pentyl, 1-Methylbutyl, 2-Methylbutyl, 3-Methylbutyl, 2,2-Di-methylpropyl, 1-Ethylpropyl, Hexyl, 1,1-Dimethylpropyl, 1,2-Dimethylpropyl, 1-Methylpentyl, 2-Methylpentyl, 3-Methylpentyl, 4-Methylpentyl, 1,1-Dimethylbutyl, 1,2-Dimethylbutyl, 1,3-Dimethylbutyl, 2,2-Dimethylbutyl, 2,3-Dimethylbutyl, 3,3-Dimethylbutyl, 1-Ethylbutyl, 2-Ethylbutyl, 1,1,2-Trimethylpropyl, 1,2,2-Trimethylpropyl, 1-Ethyl-1-methylpropyl und 1-Ethyl-2-methylpropyl;  
25

- Halogenalkyl: geradkettige oder verzweigte Alkylgruppen mit 1 bis 2, 4 oder 6 Kohlenstoffatomen (wie vorstehend genannt), wobei in diesen Gruppen teilweise oder vollständig die Wasserstoffatome durch Halogenatome wie vorstehend genannt ersetzt  
30 sein können: insbesondere C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-Halogenalkyl wie Chlormethyl, Brommethyl, Dichlormethyl, Trichlormethyl, Fluormethyl, Difluormethyl, Trifluormethyl, Chlorfluormethyl, Dichlorfluormethyl, Chlordifluormethyl, 1-Chlorethyl, 1-Bromethyl, 1-Fluorethyl, 2-Fluorethyl, 2,2-Difluorethyl, 2,2,2-Trifluorethyl, 2-Chlor-2-fluorethyl, 2-Chlor-2,2-difluorethyl, 2,2-Dichlor-2-fluorethyl, 2,2,2-Trichlorethyl, Pentafluorethyl oder 1,1,1-Trifluorprop-2-yl;

35

- Alkenyl: ungesättigte, geradkettige oder verzweigte Kohlenwasserstoffreste mit 2 bis 4, 6 oder 8 Kohlenstoffatomen und einer oder zwei Doppelbindungen in beliebiger Position, z.B. C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyl wie Ethenyl, 1-Propenyl, 2-Propenyl, 1-Methylethenyl, 1-Butenyl, 2-Butenyl, 3-Butenyl, 1-Methyl-1-propenyl, 2-Methyl-1-propenyl, 1-Methyl-2-propenyl,  
40 2-Methyl-2-propenyl, 1-Pentenyl, 2-Pentenyl, 3-Pentenyl, 4-Pentenyl, 1-Methyl-1-but-

- enyl, 2-Methyl-1-butenyl, 3-Methyl-1-butenyl, 1-Methyl-2-butenyl, 2-Methyl-2-butenyl, 3-Methyl-2-butenyl, 1-Methyl-3-butenyl, 2-Methyl-3-butenyl, 3-Methyl-3-butenyl, 1,1-Dimethyl-2-propenyl, 1,2-Dimethyl-1-propenyl, 1,2-Dimethyl-2-propenyl, 1-Ethyl-1-propenyl, 1-Ethyl-2-propenyl, 1-Hexenyl, 2-Hexenyl, 3-Hexenyl, 4-Hexenyl, 5-Hexenyl, 1-Methyl-1-pentenyl, 2-Methyl-1-pentenyl, 3-Methyl-1-pentenyl, 4-Methyl-1-pentenyl, 1-Methyl-2-pentenyl, 2-Methyl-2-pentenyl, 3-Methyl-2-pentenyl, 4-Methyl-2-pentenyl, 1-Methyl-3-pentenyl, 2-Methyl-3-pentenyl, 3-Methyl-3-pentenyl, 4-Methyl-3-pentenyl, 1-Methyl-4-pentenyl, 2-Methyl-4-pentenyl, 3-Methyl-4-pentenyl, 4-Methyl-4-pentenyl, 1,1-Dimethyl-2-butenyl, 1,1-Dimethyl-3-butenyl, 1,2-Dimethyl-1-butenyl, 1,2-Dimethyl-2-butenyl, 1,2-Dimethyl-3-butenyl, 1,3-Dimethyl-1-butenyl, 1,3-Dimethyl-2-butenyl, 1,3-Dimethyl-3-butenyl, 2,2-Dimethyl-3-butenyl, 2,3-Dimethyl-1-butenyl, 2,3-Dimethyl-2-butenyl, 2,3-Dimethyl-3-butenyl, 3,3-Dimethyl-1-butenyl, 3,3-Dimethyl-2-butenyl, 1-Ethyl-1-butenyl, 1-Ethyl-2-butenyl, 1-Ethyl-3-butenyl, 2-Ethyl-1-butenyl, 2-Ethyl-2-butenyl, 2-Ethyl-3-butenyl, 1,1,2-Trimethyl-2-propenyl, 1-Ethyl-1-methyl-2-propenyl, 1-Ethyl-2-methyl-1-propenyl und 1-Ethyl-2-methyl-2-propenyl;

- Halogenalkenyl: ungesättigte, geradkettige oder verzweigte Kohlenwasserstoffreste mit 2 bis 8 Kohlenstoffatomen und einer oder zwei Doppelbindungen in beliebiger Position (wie vorstehend genannt), wobei in diesen Gruppen die Wasserstoffatome teilweise oder vollständig gegen Halogenatome wie vorstehend genannt, insbesondere Fluor, Chlor und Brom, ersetzt sein können;

- Alkynyl: geradkettige oder verzweigte Kohlenwasserstoffgruppen mit 2 bis 4, 6 oder 8 Kohlenstoffatomen und einer oder zwei Dreifachbindungen in beliebiger Position, z.B.  $C_2$ - $C_8$ -Alkynyl wie Ethinyl, 1-Propinyl, 2-Propinyl, 1-Butinyl, 2-Butinyl, 3-Butinyl, 1-Methyl-2-propinyl, 1-Pentinyl, 2-Pentinyl, 3-Pentinyl, 4-Pentinyl, 1-Methyl-2-butinyl, 1-Methyl-3-butinyl, 2-Methyl-3-butinyl, 3-Methyl-1-butinyl, 1,1-Dimethyl-2-propinyl, 1-Ethyl-2-propinyl, 1-Hexinyl, 2-Hexinyl, 3-Hexinyl, 4-Hexinyl, 5-Hexinyl, 1-Methyl-2-pentinyl, 1-Methyl-3-pentinyl, 1-Methyl-4-pentinyl, 2-Methyl-3-pentinyl, 2-Methyl-4-pentinyl, 3-Methyl-1-pentinyl, 3-Methyl-4-pentinyl, 4-Methyl-1-pentinyl, 4-Methyl-2-pentinyl, 1,1-Dimethyl-2-butinyl, 1,1-Dimethyl-3-butinyl, 1,2-Dimethyl-3-butinyl, 2,2-Dimethyl-3-butinyl, 3,3-Dimethyl-1-butinyl, 1-Ethyl-2-butinyl, 1-Ethyl-3-butinyl, 2-Ethyl-3-butinyl und 1-Ethyl-1-methyl-2-propinyl;

- Cycloalkyl: mono- oder bicyclische, gesättigte Kohlenwasserstoffgruppen mit 3 bis 6 oder 8 Kohlenstoffringgliedern, z.B.  $C_3$ - $C_8$ -Cycloalkyl wie Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, Cycloheptyl und Cyclooctyl;

- fünf- bis zehngliedriger gesättigter, partiell ungesättigter oder aromatischer Heterocyclo-  
lus, enthaltend ein bis vier Heteroatome aus der Gruppe O, N oder S:

- 5- oder 6-gliedriges Heterocyclyl, enthaltend ein bis drei Stickstoffatome und/oder ein Sauerstoff- oder Schwefelatom oder ein oder zwei Sauerstoff- und/oder Schwefelatome, z.B. 2-Tetrahydrofuranyl, 3-Tetrahydrofuranyl, 2-Tetrahydrothienyl, 3-Tetrahydrothienyl, 2-Pyrrolidinyl, 3-Pyrrolidinyl, 3-Isoxazolidinyl, 4-Isoxazolidinyl, 5-Isoxazolidinyl, 3-Isotiazolidinyl, 4-Isotiazolidinyl, 5-Isotiazolidinyl, 3-Pyrazolidinyl, 4-Pyrazolidinyl, 5-Pyrazolidinyl, 2-Oxazolidinyl, 4-Oxazolidinyl, 5-Oxazolidinyl, 2-Thiazolidinyl, 4-Thiazolidinyl, 5-Thiazolidinyl, 2-Imidazolidinyl, 4-Imidazolidinyl, 2-Pyrrolin-2-yl, 2-Pyrrolin-3-yl, 3-Pyrrolin-2-yl, 3-Pyrrolin-3-yl, 2-Piperidinyl, 3-Piperidinyl, 4-Piperidinyl, 1,3-Dioxan-5-yl, 2-Tetrahydropyranyl, 4-Tetrahydropyranyl, 2-Tetrahydrothienyl, 3-Hexahydropyridazinyl, 4-Hexahydropyridazinyl, 2-Hexahydropyrimidinyl, 4-Hexahydropyrimidinyl, 5-Hexahydropyrimidinyl und 2-Piperazinyl;
- 5-gliedriges Heteroaryl, enthaltend ein bis vier Stickstoffatome oder ein bis drei Stickstoffatome und ein Schwefel- oder Sauerstoffatom: 5-Ring Heteroarylgruppen, welche neben Kohlenstoffatomen ein bis vier Stickstoffatome oder ein bis drei Stickstoffatome und ein Schwefel- oder Sauerstoffatom als Ringglieder enthalten können, z.B. 2-Furyl, 3-Furyl, 2-Thienyl, 3-Thienyl, 2-Pyrrolyl, 3-Pyrrolyl, 3-Pyrazolyl, 4-Pyrazolyl, 5-Pyrazolyl, 2-Oxazolyl, 4-Oxazolyl, 5-Oxazolyl, 2-Thiazolyl, 4-Thiazolyl, 5-Thiazolyl, 2-Imidazolyl, 4-Imidazolyl, und 1,3,4-Triazol-2-yl;
- 6-gliedriges Heteroaryl, enthaltend ein bis drei bzw. ein bis vier Stickstoffatome: 6-Ring Heteroarylgruppen, welche neben Kohlenstoffatomen ein bis drei bzw. ein bis vier Stickstoffatome als Ringglieder enthalten können, z.B. 2-Pyridinyl, 3-Pyridinyl, 4-Pyridinyl, 3-Pyridazinyl, 4-Pyridazinyl, 2-Pyrimidinyl, 4-Pyrimidinyl, 5-Pyrimidinyl und 2-Pyrazinyl;
- Alkylen: divalente unverzweigte Ketten aus 3 bis 5 CH<sub>2</sub>-Gruppen, z.B. CH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub> und CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>;
- Oxyalkylen: divalente unverzweigte Ketten aus 2 bis 4 CH<sub>2</sub>-Gruppen, wobei eine Valenz über ein Sauerstoffatom an das Gerüst gebunden ist, z.B. OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>, OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub> und OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>;
- Oxyalkylenoxy: divalente unverzweigte Ketten aus 1 bis 3 CH<sub>2</sub>-Gruppen, wobei beide Valenzen über ein Sauerstoffatom an das Gerüst gebunden ist, z.B. OCH<sub>2</sub>O, OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>O und OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>O;
- In dem Umfang der vorliegenden Erfindung sind die (R)- und (S)-Isomere und die Raze-mate von Verbindungen der Formel I eingeschlossen, die chirale Zentren aufweisen.

Die besonders bevorzugten Ausführungsformen der Zwischenprodukte in Bezug auf die Variablen entsprechen denen der Reste L und R<sup>3</sup> der Formel I.

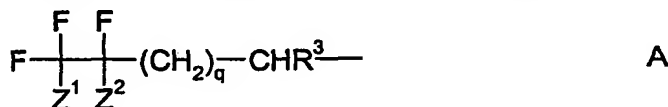
- 5 Im Hinblick auf ihre bestimmungsgemäße Verwendung der Triazolopyrimidine der Formel I sind die folgenden Bedeutungen der Substituenten, und zwar jeweils für sich allein oder in Kombination, besonders bevorzugt:

Verbindungen der Formel I werden bevorzugt, in denen R<sup>1</sup> nicht Wasserstoff bedeutet.

10

Verbindungen I werden besonders bevorzugt, in denen R<sup>1</sup> für C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl steht.

Verbindungen I sind bevorzugt, in denen R<sup>1</sup> für eine Gruppe A steht:



15

worin

- Z<sup>1</sup> Wasserstoff, Fluor oder C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Fluoroalkyl,  
 Z<sup>2</sup> Wasserstoff oder Fluor, oder  
 20 Z<sup>1</sup> und Z<sup>2</sup> bilden gemeinsam eine Doppelbindung;  
 q 0 oder 1 ist; und  
 R<sup>3</sup> Wasserstoff oder Methyl bedeuten.

- Außerdem werden Verbindungen I bevorzugt, in denen R<sup>1</sup> für C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl steht,  
 25 welches durch C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl substituiert sein kann.

Insbesondere werden Verbindungen I bevorzugt, in denen R<sup>2</sup> Wasserstoff bedeutet.

- Gleichermaßen bevorzugt sind Verbindungen I, in denen R<sup>2</sup> für Methyl oder Ethyl steht.

30

Sofern R<sup>1</sup> und/oder R<sup>2</sup> Halogenalkyl oder Halogenalkenylgruppen mit Chiralitätszentrum beinhalten, sind für diese Gruppen die (S)- Isomere bevorzugt. Im Fall halogenfreier Alkyl oder Alkenylgruppen mit Chiralitätszentrum in R<sup>1</sup> oder R<sup>2</sup> sind die (R)-konfigurierten Isomere bevorzugt.

35

Weiterhin werden Verbindungen I bevorzugt, in denen R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen Piperidiny-, Morpholinyl- oder Thiomorpholinylring bilden, insbesondere einen Piperidinyring, der ggf. durch eine bis drei

13

Gruppen Halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl substituiert ist. Besonders bevorzugt sind die Verbindungen, in denen R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen 4-Methylpiperidinring bilden.

- 5 Ein weiterer bevorzugter Gegenstand der Erfindung sind Verbindungen I, in denen R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen Pyrazolring bilden, der ggf. durch eine oder zwei Gruppen Halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, insbesondere durch 3,5-Dimethyl oder 3,5-Di-(trifluormethyl) substituiert ist.

10

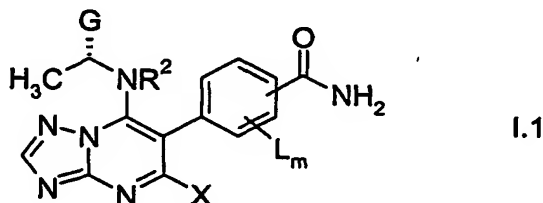
Daneben sind auch Verbindungen der Formel I besonders bevorzugt, in denen R<sup>1</sup> CH(CH<sub>3</sub>)-CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, CH(CH<sub>3</sub>)-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, CH(CH<sub>3</sub>)-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, CH(CH<sub>3</sub>)-CF<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>C(CH<sub>3</sub>)=CH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH=CH<sub>2</sub>, Cyclopentyl oder Cyclohexyl; R<sup>2</sup> Wasserstoff oder Methyl; oder R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> gemeinsam -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>CH(CH<sub>3</sub>)(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-, -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>CH(CF<sub>3</sub>)(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>- oder -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>O(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>- bedeuten.

15

Verbindungen I werden bevorzugt, in denen X Halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, Cyano oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, wie Chlor, Methyl, Cyano, Methoxy oder Ethoxy, besonders Chlor oder Methyl, insbesondere Chlor bedeutet.

20

Eine bevorzugte Ausführungsform der Verbindungen der Formel I betrifft Verbindungen der Formel I.1:



in der

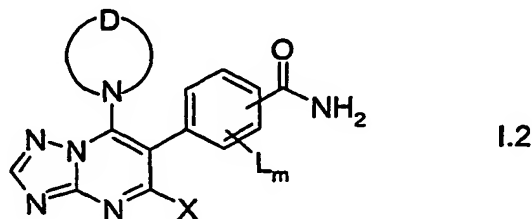
- 25 G C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, insbesondere Ethyl, n- und i-Propyl, n-, sek-, tert- Butyl, und C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxymethyl, insbesondere Ethoxymethyl, oder C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl, insbesondere Cyclopentyl oder Cyclohexyl;  
R<sup>2</sup> Wasserstoff oder Methyl; und  
X Chlor, Methyl, Cyano, Methoxy oder Ethoxy bedeuten.

30

Eine weitere bevorzugte Ausführungsform der Verbindungen der Formel I betrifft Verbindungen, in denen R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, ein fünf- oder sechsgliedriges Heterocycl oder Heteroaryl bilden, welches über N gebunden ist und ein weiteres Heteroatom aus der Gruppe O, N und S als  
35 Ringglied enthalten und/oder einen oder mehrere Substituenten aus der Gruppe Halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl,

14

C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkenyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkoxy, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyloxy, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkenyloxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylen und Oxy-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alkylenoxy tragen kann. Diese Verbindungen entsprechen insbesondere Formel I.2,



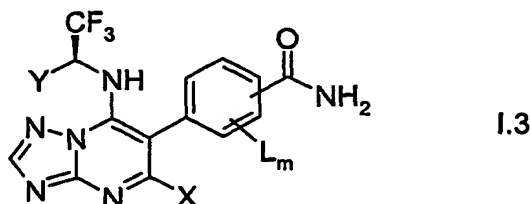
5 in der

D zusammen mit dem Stickstoffatom ein fünf- oder sechsgliedriges Heterocyclid oder Heteroaryl bildet, welches über N gebunden ist und ein weiteres Heteroatom aus der Gruppe O, N und S als Ringglied enthalten und/oder einen oder mehrere Substituenten aus der Gruppe Halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy und

10 C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-Halogenalkyl tragen kann; und

X Chlor, Methyl, Cyano, Methoxy oder Ethoxy bedeuten.

Eine weitere bevorzugte Ausführungsform der Verbindungen der Formel I betrifft Verbindungen der Formel I.3.



15

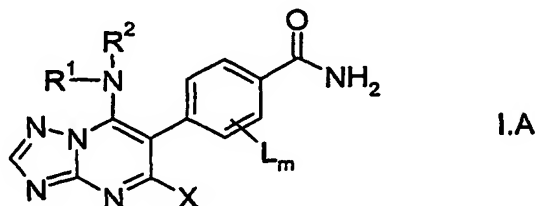
in der Y für Wasserstoff oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, insbesondere für Methyl und Ethyl, und X für Chlor, Methyl, Cyano, Methoxy oder Ethoxy steht.

20

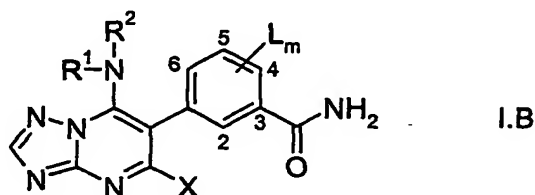
Verbindungen der Formel I sind besonders bevorzugt, in denen mindestens ein Substituent L ortho-ständig zu der Bindung mit dem Triazolopyrimidin-Gerüst steht, insbesondere ein Substituent aus Chlor, Fluor oder Methyl.

25

Eine weitere bevorzugte Ausführungsform der Erfindung betrifft Verbindungen der Formel I, in der die Gruppe C(O)NH<sub>2</sub> in 4-Position steht; die Verbindungen entsprechen Formel I.A.

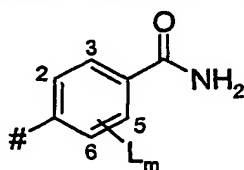


Eine weitere bevorzugte Ausführungsform der Erfindung betrifft Verbindungen der Formel I, in der die Gruppe C(O)NH<sub>2</sub> in 3-Position steht; die Verbindungen entsprechen Formel I.B.

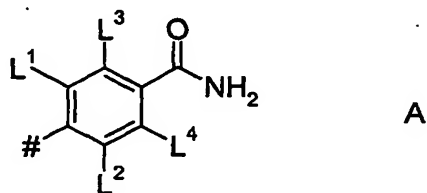


5

Besonders bevorzugt sind Verbindungen der Formel I.A, in der die Phenylgruppe



der Gruppe A entspricht:



10

in der

- L<sup>1</sup> Halogen, Halogenmethyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, insbesondere Cl, F oder Methyl;  
 L<sup>2</sup>, L<sup>3</sup>, L<sup>4</sup> Wasserstoff oder Halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-Halogenalkyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy bedeuten,

15 wobei # die Verknüpfungsstelle zu dem Triazolopyrimidin-Gerüst kennzeichnet.

Insbesondere sind im Hinblick auf ihre Verwendung die in den folgenden Tabellen zusammengestellten Verbindungen I bevorzugt. Die in den Tabellen für einen Substituenten genannten Gruppen stellen außerdem für sich betrachtet, unabhängig von der Kombination, in der sie genannt sind, eine besonders bevorzugte Ausgestaltung des betreffenden Substituenten dar.

Tabelle 1

Verbindungen der Formel I.A, in denen X Chlor, L<sub>m</sub> 2-Chlor und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

25

## Tabelle 2

Verbindungen der Formel I.A, in denen X Cyano,  $L_m$  2-Chlor und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## 5 Tabelle 3

Verbindungen der Formel I.A, in denen X Methyl,  $L_m$  2-Chlor und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 4

10 Verbindungen der Formel I.A, in denen X Methoxy,  $L_m$  2-Chlor und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 5

15 Verbindungen der Formel I.A, in denen X Chlor,  $L_m$  2-Fluor und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 6

20 Verbindungen der Formel I.A, in denen X Cyano,  $L_m$  2-Fluor und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 7

Verbindungen der Formel I.A, in denen X Methyl,  $L_m$  2-Fluor und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## 25 Tabelle 8

Verbindungen der Formel I.A, in denen X Methoxy,  $L_m$  2-Fluor und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 9

30 Verbindungen der Formel I.A, in denen X Chlor,  $L_m$  2-Chlor-6-Fluor und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 10

35 Verbindungen der Formel I.A, in denen X Cyano,  $L_m$  2-Chlor-6-Fluor und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 11

40 Verbindungen der Formel I.A, in denen X Methyl,  $L_m$  2-Chlor-6-Fluor und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

**Tabelle 12**

Verbindungen der Formel I.A, in denen X Methoxy,  $L_m$  2-Chlor-6-Fluor und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

**5 Tabelle 13**

Verbindungen der Formel I.A, in denen X Chlor,  $L_m$  2,6-Dichlor und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

**Tabelle 14**

**10** Verbindungen der Formel I.A, in denen X Cyano,  $L_m$  2,6-Dichlor und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

**Tabelle 15**

**15** Verbindungen der Formel I.A, in denen X Methyl,  $L_m$  2,6-Dichlor und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

**Tabelle 16**

**20** Verbindungen der Formel I.A, in denen X Methoxy,  $L_m$  2,6-Dichlor und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

**Tabelle 17**

Verbindungen der Formel I.A, in denen X Chlor,  $L_m$  2,6-Difluor und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

**25 Tabelle 18**

Verbindungen der Formel I.A, in denen X Cyano,  $L_m$  2,6-Difluor und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

**Tabelle 19**

**30** Verbindungen der Formel I.A, in denen X Methyl,  $L_m$  2,6-Difluor und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

**Tabelle 20**

**35** Verbindungen der Formel I.A, in denen X Methoxy,  $L_m$  2,6-Difluor und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

**Tabelle 21**

**40** Verbindungen der Formel I.A, in denen X Chlor,  $L_m$  2-Methyl und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

**Tabelle 22**

Verbindungen der Formel I.A, in denen X Cyano, L<sub>m</sub> 2-Methyl und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

**5 Tabelle 23**

Verbindungen der Formel I.A, in denen X Methyl, L<sub>m</sub> 2-Methyl und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

**Tabelle 24**

**10** Verbindungen der Formel I.A, in denen X Methoxy, L<sub>m</sub> 2-Methyl und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

**Tabelle 25**

**15** Verbindungen der Formel I.A, in denen X Chlor, L<sub>m</sub> 2-Chlor,5-fluor und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

**Tabelle 26**

**20** Verbindungen der Formel I.A, in denen X Cyano, L<sub>m</sub> 2-Chlor,5-fluor und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

**Tabelle 27**

Verbindungen der Formel I.A, in denen X Methyl, L<sub>m</sub> 2-Chlor,5-fluor und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

**25 Tabelle 28**

Verbindungen der Formel I.A, in denen X Methoxy, L<sub>m</sub> 2-Chlor,5-fluor und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

**Tabelle 29**

**30** Verbindungen der Formel I.A, in denen X Chlor, L<sub>m</sub> 2,5-Difluor und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

**Tabelle 30**

**35** Verbindungen der Formel I.A, in denen X Cyano, L<sub>m</sub> 2,5-Difluor und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

**Tabelle 31**

**40** Verbindungen der Formel I.A, in denen X Methyl, L<sub>m</sub> 2,5-Difluor und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

**Tabelle 32**

Verbindungen der Formel I.A, in denen X Methoxy,  $L_m$  2,5-Difluor und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

**5 Tabelle 33**

Verbindungen der Formel I.A, in denen X Chlor,  $L_m$  2-Chlor,3,6-difluor und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

**Tabelle 34**

**10** Verbindungen der Formel I.A, in denen X Cyano,  $L_m$  2-Chlor,3,6-difluor und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

**Tabelle 35**

**15** Verbindungen der Formel I.A, in denen X Methyl,  $L_m$  2-Chlor,3,6-difluor und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

**Tabelle 36**

**20** Verbindungen der Formel I.A, in denen X Methoxy,  $L_m$  2-Chlor,3,6-difluor und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

**Tabelle 37**

Verbindungen der Formel I.A, in denen X Chlor,  $L_m$  2-Chlor,5,6-difluor und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

**25 Tabelle 38**

Verbindungen der Formel I.A, in denen X Cyano,  $L_m$  2-Chlor,5,6-difluor und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

**Tabelle 39**

**30** Verbindungen der Formel I.A, in denen X Methyl,  $L_m$  2-Chlor,5,6-difluor und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

**Tabelle 40**

**35** Verbindungen der Formel I.A, in denen X Methoxy,  $L_m$  2-Chlor,5,6-difluor und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

**Tabelle 41**

**40** Verbindungen der Formel I.A, in denen X Chlor,  $L_m$  2,6-Dichlor,5-fluor und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

**Tabelle 42**

Verbindungen der Formel I.A, in denen X Cyano, L<sub>m</sub> 2,6-Dichlor,5-fluor und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

**5 Tabelle 43**

Verbindungen der Formel I.A, in denen X Methyl, L<sub>m</sub> 2,6-Dichlor,5-fluor und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

**Tabelle 44**

**10** Verbindungen der Formel I.A, in denen X Methoxy, L<sub>m</sub> 2,6-Dichlor,5-fluor und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

**Tabelle 45**

**15** Verbindungen der Formel I.A, in denen X Chlor, L<sub>m</sub> 2,3,6-Trifluor und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

**Tabelle 46**

**20** Verbindungen der Formel I.A, in denen X Cyano, L<sub>m</sub> 2,3,6-Trifluor und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

**Tabelle 47**

Verbindungen der Formel I.A, in denen X Methyl, L<sub>m</sub> 2,3,6-Trifluor und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

**25 Tabelle 48**

Verbindungen der Formel I.A, in denen X Methoxy, L<sub>m</sub> 2,3,6-Trifluor und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

**Tabelle 49**

**30** Verbindungen der Formel I.A, in denen X Chlor, L<sub>m</sub> 2-Methyl,5-fluor und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

**Tabelle 50**

**35** Verbindungen der Formel I.A, in denen X Cyano, L<sub>m</sub> 2-Methyl,5-fluor und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

**Tabelle 51**

**40** Verbindungen der Formel I.A, in denen X Methyl, L<sub>m</sub> 2-Methyl,5-fluor und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

**Tabelle 52**

Verbindungen der Formel I.A, in denen X Methoxy,  $L_m$  2-Methyl,5-fluor und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

**5 Tabelle 53**

Verbindungen der Formel I.A, in denen X Chlor,  $L_m$  2,5-Dichlor und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

**Tabelle 54**

**10** Verbindungen der Formel I.A, in denen X Cyano,  $L_m$  2,5-Dichlor und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

**Tabelle 55**

**15** Verbindungen der Formel I.A, in denen X Methyl,  $L_m$  2,5-Dichlor und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

**Tabelle 56**

**20** Verbindungen der Formel I.A, in denen X Methoxy,  $L_m$  2,5-Dichlor und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

**Tabelle 57**

Verbindungen der Formel I.A, in denen X Chlor,  $L_m$  2-Fluor,5-chlor und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

**25 Tabelle 58**

Verbindungen der Formel I.A, in denen X Cyano,  $L_m$  2-Fluor,5-chlor und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

**Tabelle 59**

**30** Verbindungen der Formel I.A, in denen X Methyl,  $L_m$  2-Fluor,5-chlor und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

**Tabelle 60**

**35** Verbindungen der Formel I.A, in denen X Methoxy,  $L_m$  2-Fluor,5-chlor und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

**Tabelle 61**

**40** Verbindungen der Formel I.A, in denen X Chlor,  $L_m$  2,3-Dichlor,6-fluor und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

**Tabelle 62**

Verbindungen der Formel I.A, in denen X Cyano,  $L_m$  2,3-Dichlor,6-fluor und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

**5    Tabelle 63**

Verbindungen der Formel I.A, in denen X Methyl,  $L_m$  2,3-Dichlor,6-fluor und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

**Tabelle 64**

**10    Verbindungen der Formel I.A, in denen X Methoxy,  $L_m$  2,3-Dichlor,6-fluor und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht**

**Tabelle 65**

**15    Verbindungen der Formel I.A, in denen X Chlor,  $L_m$  2,5-Dichlor,6-fluor und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht**

**Tabelle 66**

**20    Verbindungen der Formel I.A, in denen X Cyano,  $L_m$  2,5-Dichlor,6-fluor und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht**

**Tabelle 67**

Verbindungen der Formel I.A, in denen X Methyl,  $L_m$  2,5-Dichlor,6-fluor und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

**25    Tabelle 68**

Verbindungen der Formel I.A, in denen X Methoxy,  $L_m$  2,5-Dichlor,6-fluor und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

**Tabelle 69**

**30    Verbindungen der Formel I.A, in denen X Chlor,  $L_m$  2,3,6-Trichlor und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht**

**Tabelle 70**

**35    Verbindungen der Formel I.A, in denen X Cyano,  $L_m$  2,3,6-Trichlor und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht**

**Tabelle 71**

**40    Verbindungen der Formel I.A, in denen X Methyl,  $L_m$  2,3,6-Trichlor und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht**

**Tabelle 72**

Verbindungen der Formel I.A, in denen X Methoxy,  $L_m$  2,3,6-Trichlor und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

**5 Tabelle 73**

Verbindungen der Formel I.A, in denen X Chlor,  $L_m$  2,6-Difluor,5-chlor und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

**Tabelle 74**

**10** Verbindungen der Formel I.A, in denen X Cyano,  $L_m$  2,6-Difluor,5-chlor und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

**Tabelle 75**

**15** Verbindungen der Formel I.A, in denen X Methyl,  $L_m$  2,6-Difluor,5-chlor und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

**Tabelle 76**

**20** Verbindungen der Formel I.A, in denen X Methoxy,  $L_m$  2,6-Difluor,5-chlor und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

**Tabelle 77**

Verbindungen der Formel I.A, in denen X Chlor,  $L_m$  2-Methyl,5-chlor und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

**25 Tabelle 78**

Verbindungen der Formel I.A, in denen X Cyano,  $L_m$  2-Methyl,5-chlor und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

**Tabelle 79**

**30** Verbindungen der Formel I.A, in denen X Methyl,  $L_m$  2-Methyl,5-chlor und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

**Tabelle 80**

**35** Verbindungen der Formel I.A, in denen X Methoxy,  $L_m$  2-Methyl,5-chlor und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

**Tabelle 81**

**40** Verbindungen der Formel I.A, in denen X Chlor,  $L_m$  2-Chlor,5-Methyl und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

**Tabelle 82**

Verbindungen der Formel I.A, in denen X Cyano, L<sub>m</sub> 2-Chlor,5-Methyl und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

**5    Tabelle 83**

Verbindungen der Formel I.A, in denen X Methyl, L<sub>m</sub> 2-Chlor,5-Methyl und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

**Tabelle 84**

- 10    Verbindungen der Formel I.A, in denen X Methoxy, L<sub>m</sub> 2-Chlor,5-Methyl und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht**

**Tabelle 85**

- 15    Verbindungen der Formel I.A, in denen X Chlor, L<sub>m</sub> 2-Fluor,5-methyl und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht**

**Tabelle 86**

- 20    Verbindungen der Formel I.A, in denen X Cyano, L<sub>m</sub> 2-Fluor,5-methyl und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht**

**Tabelle 87**

Verbindungen der Formel I.A, in denen X Methyl, L<sub>m</sub> 2-Fluor,5-methyl und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

**25    Tabelle 88**

Verbindungen der Formel I.A, in denen X Methoxy, L<sub>m</sub> 2-Fluor,5-methyl und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

**Tabelle 89**

- 30    Verbindungen der Formel I.A, in denen X Chlor, L<sub>m</sub> 2-Chlor,5-methyl,6-fluor und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht**

**Tabelle 90**

- 35    Verbindungen der Formel I.A, in denen X Cyano, L<sub>m</sub> 2-Chlor,5-methyl,6-fluor und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht**

**Tabelle 91**

- 40    Verbindungen der Formel I.A, in denen X Methyl, L<sub>m</sub> 2-Chlor,5-methyl,6-fluor und die**

Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

**Tabelle 92**

- 5 Verbindungen der Formel I.A, in denen X Methoxy,  $L_m$  2-Chlor,5-methyl,6-fluor und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

**Tabelle 93**

- 10 Verbindungen der Formel I.A, in denen X Chlor,  $L_m$  2-Chlor,3-methyl,6-fluor und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

**Tabelle 94**

- 15 Verbindungen der Formel I.A, in denen X Cyano,  $L_m$  2-Chlor,3-methyl,6-fluor und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

**Tabelle 95**

- 20 Verbindungen der Formel I.A, in denen X Methyl,  $L_m$  2-Chlor,3-methyl,6-fluor und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

**Tabelle 96**

- 25 Verbindungen der Formel I.A, in denen X Methoxy,  $L_m$  2-Chlor,3-methyl,6-fluor und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

**Tabelle 97**

- 30 Verbindungen der Formel I.A, in denen X Chlor,  $L_m$  2,6-Dichlor,5-methyl und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

**Tabelle 98**

- 35 Verbindungen der Formel I.A, in denen X Cyano,  $L_m$  2,6-Dichlor,5-methyl und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

**Tabelle 99**

- Verbindungen der Formel I.A, in denen X Methyl,  $L_m$  2,6-Dichlor,5-methyl und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

spricht

**Tabelle 100**

5 Verbindungen der Formel I.A, in denen X Methoxy,  $L_m$  2,6-Dichlor,5-methyl und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

**Tabelle 101**

10 Verbindungen der Formel I.A, in denen X Chlor,  $L_m$  2,6-Difluor,3-methyl und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

**Tabelle 102**

15 Verbindungen der Formel I.A, in denen X Cyano,  $L_m$  2,6-Difluor,3-methyl und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

**Tabelle 103**

Verbindungen der Formel I.A, in denen X Methyl,  $L_m$  2,6-Difluor,3-methyl und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

20 **Tabelle 104**

Verbindungen der Formel I.A, in denen X Methoxy,  $L_m$  2,6-Difluor,3-methyl und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

25 **Tabelle 105**

Verbindungen der Formel I.A, in denen X Chlor,  $L_m$  2,5-Dimethyl und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

**Tabelle 106**

30 Verbindungen der Formel I.A, in denen X Cyano,  $L_m$  2,5-Dimethyl und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

**Tabelle 107**

35 Verbindungen der Formel I.A, in denen X Methyl,  $L_m$  2,5-Dimethyl und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

**Tabelle 108**

40 Verbindungen der Formel I.A, in denen X Methoxy,  $L_m$  2,5-Dimethyl und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 109

Verbindungen der Formel I.A, in denen X Chlor, L<sub>m</sub> 2-Chlor,5-methoxy und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## 5 Tabelle 110

Verbindungen der Formel I.A, in denen X Cyano, L<sub>m</sub> 2-Chlor,5-methoxy und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 111

- 10 Verbindungen der Formel I.A, in denen X Methyl, L<sub>m</sub> 2-Chlor,5-methoxy und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 112

- 15 Verbindungen der Formel I.A, in denen X Methoxy, L<sub>m</sub> 2-Chlor,5-methoxy und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 113

- 20 Verbindungen der Formel I.A, in denen X Chlor, L<sub>m</sub> 2-Fluor,5-methoxy und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 114

- 25 Verbindungen der Formel I.A, in denen X Cyano, L<sub>m</sub> 2-Fluor,5-methoxy und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 115

- Verbindungen der Formel I.A, in denen X Methyl, L<sub>m</sub> 2-Fluor,5-methoxy und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## 30 Tabelle 116

Verbindungen der Formel I.A, in denen X Methoxy, L<sub>m</sub> 2-Fluor,5-methoxy und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## 35 Tabelle 117

Verbindungen der Formel I.A, in denen X Chlor, L<sub>m</sub> 2-Chlor,3-methoxy,6-fluor und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

**Tabelle 118**

Verbindungen der Formel I.A, in denen X Cyano, L<sub>m</sub> 2-Chlor,3-methoxy,6-fluor und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

5

**Tabelle 119**

Verbindungen der Formel I.A, in denen X Methyl, L<sub>m</sub> 2-Chlor,3-methoxy,6-fluor und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

10

**Tabelle 120**

Verbindungen der Formel I.A, in denen X Methoxy, L<sub>m</sub> 2-Chlor,3-methoxy,6-fluor und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

15

**Tabelle 121**

Verbindungen der Formel I.A, in denen X Chlor, L<sub>m</sub> 2-Chlor,5-methoxy,6-fluor und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

20

**Tabelle 122**

Verbindungen der Formel I.A, in denen X Cyano, L<sub>m</sub> 2-Chlor,5-methoxy,6-fluor und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

25

**Tabelle 123**

Verbindungen der Formel I.A, in denen X Methyl, L<sub>m</sub> 2-Chlor,5-methoxy,6-fluor und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

30

**Tabelle 124**

Verbindungen der Formel I.A, in denen X Methoxy, L<sub>m</sub> 2-Chlor,5-methoxy,6-fluor und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

35

**Tabelle 125**

Verbindungen der Formel I.A, in denen X Chlor, L<sub>m</sub> 2,6-Dichlor,5-methoxy und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

40

## Tabelle 126

Verbindungen der Formel I.A, in denen X Cyano, L<sub>m</sub> 2,6-Dichlor,5-methoxy und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

5

## Tabelle 127

Verbindungen der Formel I.A, in denen X Methyl, L<sub>m</sub> 2,6-Dichlor,5-methoxy und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

10

## Tabelle 128

Verbindungen der Formel I.A, in denen X Methoxy, L<sub>m</sub> 2,6-Dichlor,5-methoxy und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

15

## Tabelle 129

Verbindungen der Formel I.A, in denen X Chlor, L<sub>m</sub> 2,6-Difluor,3-methoxy und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

20

## Tabelle 130

Verbindungen der Formel I.A, in denen X Cyano, L<sub>m</sub> 2,6-Difluor,3-methoxy und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

25

## Tabelle 131

Verbindungen der Formel I.A, in denen X Methyl, L<sub>m</sub> 2,6-Difluor,3-methoxy und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

30

## Tabelle 132

Verbindungen der Formel I.A, in denen X Methoxy, L<sub>m</sub> 2,6-Difluor,3-methoxy und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

35

## Tabelle 133

Verbindungen der Formel I.A, in denen X Chlor, L<sub>m</sub> 2-Methyl,5-methoxy und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

**Tabelle 134**

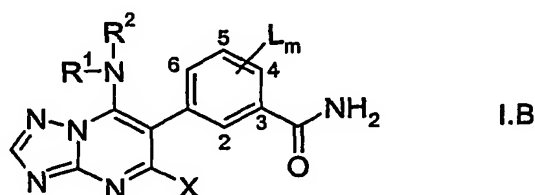
Verbindungen der Formel I.A, in denen X Cyano, L<sub>m</sub> 2-Methyl,5-methoxy und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

**5 Tabelle 135**

Verbindungen der Formel I.A, in denen X Methyl, L<sub>m</sub> 2-Methyl,5-methoxy und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

**Tabelle 136**

- 10** Verbindungen der Formel I.A, in denen X Methoxy, L<sub>m</sub> 2-Methyl,5-methoxy und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht



**15 Tabelle 137**

Verbindungen der Formel I.B, in denen X Chlor, L<sub>m</sub> 2-Chlor und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

**Tabelle 138**

- 20** Verbindungen der Formel I.B, in denen X Cyano, L<sub>m</sub> 2-Chlor und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

**Tabelle 139**

- 25** Verbindungen der Formel I.B, in denen X Methyl, L<sub>m</sub> 2-Chlor und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

**Tabelle 140**

Verbindungen der Formel I.B, in denen X Methoxy, L<sub>m</sub> 2-Chlor und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

30

**Tabelle 141**

Verbindungen der Formel I.B, in denen X Chlor, L<sub>m</sub> 2-Fluor und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

35

**Tabelle 142**

Verbindungen der Formel I.B, in denen X Cyano, L<sub>m</sub> 2-Fluor und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

**5 Tabelle 143**

Verbindungen der Formel I.B, in denen X Methyl, L<sub>m</sub> 2-Fluor und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

**Tabelle 144**

**10** Verbindungen der Formel I.B, in denen X Methoxy, L<sub>m</sub> 2-Fluor und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

**Tabelle 145**

**15** Verbindungen der Formel I.B, in denen X Chlor, L<sub>m</sub> 2-Chlor,6-fluor und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

**Tabelle 146**

**20** Verbindungen der Formel I.B, in denen X Cyano, L<sub>m</sub> 2-Chlor,6-fluor und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

**Tabelle 147**

Verbindungen der Formel I.B, in denen X Methyl, L<sub>m</sub> 2-Chlor,6-fluor und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

**25 Tabelle 148**

Verbindungen der Formel I.B, in denen X Methoxy, L<sub>m</sub> 2-Chlor,6-fluor und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

**Tabelle 149**

**30** Verbindungen der Formel I.B, in denen X Chlor, L<sub>m</sub> 2,6-Dichlor und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

**Tabelle 150**

**35** Verbindungen der Formel I.B, in denen X Cyano, L<sub>m</sub> 2,6-Dichlor und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

**Tabelle 151**

Verbindungen der Formel I.B, in denen X Methyl, L<sub>m</sub> 2,6-Dichlor und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

**Tabelle 152**

Verbindungen der Formel I.B, in denen X Methoxy,  $L_m$  2,6-Dichlor und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

**5 Tabelle 153**

Verbindungen der Formel I.B, in denen X Chlor,  $L_m$  2,6-Difluor und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

**Tabelle 154**

- 10** Verbindungen der Formel I.B, in denen X Cyano,  $L_m$  2,6-Difluor und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

**Tabelle 155**

- 15** Verbindungen der Formel I.B, in denen X Methyl,  $L_m$  2,6-Difluor und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

**Tabelle 156**

- 20** Verbindungen der Formel I.B, in denen X Methoxy,  $L_m$  2,6-Difluor und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

**Tabelle 157**

Verbindungen der Formel I.B, in denen X Chlor,  $L_m$  2-Methyl und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

**25 Tabelle 158**

Verbindungen der Formel I.B, in denen X Cyano,  $L_m$  2-Methyl und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

**Tabelle 159**

- 30** Verbindungen der Formel I.B, in denen X Methyl,  $L_m$  2-Methyl und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

**Tabelle 160**

- 35** Verbindungen der Formel I.B, in denen X Methoxy,  $L_m$  2-Methyl und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

**Tabelle 161**

- 40** Verbindungen der Formel I.B, in denen X Chlor,  $L_m$  6-Chlor und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

**Tabelle 162**

Verbindungen der Formel I.B, in denen X Cyano, L<sub>m</sub> 6-Chlor und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

**5 Tabelle 163**

Verbindungen der Formel I.B, in denen X Methyl, L<sub>m</sub> 6-Chlor und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

**Tabelle 164**

**10** Verbindungen der Formel I.B, in denen X Methoxy, L<sub>m</sub> 6-Chlor und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

**Tabelle 165**

**15** Verbindungen der Formel I.B, in denen X Chlor, L<sub>m</sub> 6-Fluor und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

**Tabelle 166**

**20** Verbindungen der Formel I.B, in denen X Cyano, L<sub>m</sub> 6-Fluor und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

**Tabelle 167**

Verbindungen der Formel I.B, in denen X Methyl, L<sub>m</sub> 6-Fluor und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

**25 Tabelle 168**

Verbindungen der Formel I.B, in denen X Methoxy, L<sub>m</sub> 6-Fluor und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

**Tabelle 169**

**30** Verbindungen der Formel I.B, in denen X Chlor, L<sub>m</sub> 2-Fluor,6-chlor und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

**Tabelle 170**

**35** Verbindungen der Formel I.B, in denen X Cyano, L<sub>m</sub> 2-Fluor,6-chlor und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

**Tabelle 171**

Verbindungen der Formel I.B, in denen X Methyl, L<sub>m</sub> 2-Fluor,6-chlor und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

**Tabelle 172**

Verbindungen der Formel I.B, in denen X Methoxy, L<sub>m</sub> 2-Fluor,6-chlor und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

**5 Tabelle 173**

Verbindungen der Formel I.B, in denen X Chlor, L<sub>m</sub> 6-Methyl und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

**Tabelle 174**

**10** Verbindungen der Formel I.B, in denen X Cyano, L<sub>m</sub> 6-Methyl und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

**Tabelle 175**

**15** Verbindungen der Formel I.B, in denen X Methyl, L<sub>m</sub> 6-Methyl und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

**Tabelle 176**

**20** Verbindungen der Formel I.B, in denen X Methoxy, L<sub>m</sub> 6-Methyl und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

**Tabelle A**

| Nr.  | R <sup>1</sup>                                  | R <sup>2</sup>                                  |
|------|-------------------------------------------------|-------------------------------------------------|
| A-1  | H                                               | H                                               |
| A-2  | CH <sub>3</sub>                                 | H                                               |
| A-3  | CH <sub>3</sub>                                 | CH <sub>3</sub>                                 |
| A-4  | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 | H                                               |
| A-5  | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub>                                 |
| A-6  | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 |
| A-7  | CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>                 | H                                               |
| A-8  | CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub>                                 |
| A-9  | CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 |
| A-10 | CH <sub>2</sub> CCl <sub>3</sub>                | H                                               |
| A-11 | CH <sub>2</sub> CCl <sub>3</sub>                | CH <sub>3</sub>                                 |
| A-12 | CH <sub>2</sub> CCl <sub>3</sub>                | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 |
| A-13 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | H                                               |
| A-14 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>                                 |
| A-15 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 |
| A-16 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |

| Nr.  | R <sup>1</sup>                                                  | R <sup>2</sup>                                                  |
|------|-----------------------------------------------------------------|-----------------------------------------------------------------|
| A-17 | CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                               | H                                                               |
| A-18 | CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                               | CH <sub>3</sub>                                                 |
| A-19 | CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                               | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                                 |
| A-20 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | H                                                               |
| A-21 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>                                                 |
| A-22 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                                 |
| A-23 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 |
| A-24 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |
| A-25 | (±) CH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>        | H                                                               |
| A-26 | (±) CH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>        | CH <sub>3</sub>                                                 |
| A-27 | (±) CH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>        | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                                 |
| A-28 | (S) CH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>        | H                                                               |
| A-29 | (S) CH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>        | CH <sub>3</sub>                                                 |
| A-30 | (S) CH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>        | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                                 |
| A-31 | (R) CH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>        | H                                                               |
| A-32 | (R) CH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>        | CH <sub>3</sub>                                                 |
| A-33 | (R) CH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>        | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                                 |
| A-34 | (±) CH(CH <sub>3</sub> )-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>      | H                                                               |
| A-35 | (±) CH(CH <sub>3</sub> )-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>      | CH <sub>3</sub>                                                 |
| A-36 | (±) CH(CH <sub>3</sub> )-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>      | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                                 |
| A-37 | (S) CH(CH <sub>3</sub> )-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>      | H                                                               |
| A-38 | (S) CH(CH <sub>3</sub> )-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>      | CH <sub>3</sub>                                                 |
| A-39 | (S) CH(CH <sub>3</sub> )-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>      | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                                 |
| A-40 | (R) CH(CH <sub>3</sub> )-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>      | H                                                               |
| A-41 | (R) CH(CH <sub>3</sub> )-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>      | CH <sub>3</sub>                                                 |
| A-42 | (R) CH(CH <sub>3</sub> )-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>      | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                                 |
| A-43 | (±) CH(CH <sub>3</sub> )-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>       | H                                                               |
| A-44 | (±) CH(CH <sub>3</sub> )-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>       | CH <sub>3</sub>                                                 |
| A-45 | (±) CH(CH <sub>3</sub> )-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>       | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                                 |
| A-46 | (S) CH(CH <sub>3</sub> )-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>       | H                                                               |
| A-47 | (S) CH(CH <sub>3</sub> )-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>       | CH <sub>3</sub>                                                 |
| A-48 | (S) CH(CH <sub>3</sub> )-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>       | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                                 |
| A-49 | (R) CH(CH <sub>3</sub> )-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>       | H                                                               |
| A-50 | (R) CH(CH <sub>3</sub> )-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>       | CH <sub>3</sub>                                                 |
| A-51 | (R) CH(CH <sub>3</sub> )-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>       | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                                 |
| A-52 | (±) CH(CH <sub>3</sub> )-CF <sub>3</sub>                        | H                                                               |
| A-53 | (±) CH(CH <sub>3</sub> )-CF <sub>3</sub>                        | CH <sub>3</sub>                                                 |

| Nr.  | R <sup>1</sup>                                                  | R <sup>2</sup>                  |
|------|-----------------------------------------------------------------|---------------------------------|
| A-54 | (±) CH(CH <sub>3</sub> )-CF <sub>3</sub>                        | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |
| A-55 | (S) CH(CH <sub>3</sub> )-CF <sub>3</sub>                        | H                               |
| A-56 | (S) CH(CH <sub>3</sub> )-CF <sub>3</sub>                        | CH <sub>3</sub>                 |
| A-57 | (S) CH(CH <sub>3</sub> )-CF <sub>3</sub>                        | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |
| A-58 | (R) CH(CH <sub>3</sub> )-CF <sub>3</sub>                        | H                               |
| A-59 | (R) CH(CH <sub>3</sub> )-CF <sub>3</sub>                        | CH <sub>3</sub>                 |
| A-60 | (R) CH(CH <sub>3</sub> )-CF <sub>3</sub>                        | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |
| A-61 | (±) CH(CH <sub>3</sub> )-CCl <sub>3</sub>                       | H                               |
| A-62 | (±) CH(CH <sub>3</sub> )-CCl <sub>3</sub>                       | CH <sub>3</sub>                 |
| A-63 | (±) CH(CH <sub>3</sub> )-CCl <sub>3</sub>                       | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |
| A-64 | (S) CH(CH <sub>3</sub> )-CCl <sub>3</sub>                       | H                               |
| A-65 | (S) CH(CH <sub>3</sub> )-CCl <sub>3</sub>                       | CH <sub>3</sub>                 |
| A-66 | (S) CH(CH <sub>3</sub> )-CCl <sub>3</sub>                       | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |
| A-67 | (R) CH(CH <sub>3</sub> )-CCl <sub>3</sub>                       | H                               |
| A-68 | (R) CH(CH <sub>3</sub> )-CCl <sub>3</sub>                       | CH <sub>3</sub>                 |
| A-69 | (R) CH(CH <sub>3</sub> )-CCl <sub>3</sub>                       | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |
| A-70 | CH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>                 | H                               |
| A-71 | CH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub>                 |
| A-72 | CH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |
| A-73 | CH <sub>2</sub> (CF <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | H                               |
| A-74 | CH <sub>2</sub> (CF <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>                 |
| A-75 | CH <sub>2</sub> (CF <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |
| A-76 | CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> )=CH <sub>2</sub>             | H                               |
| A-77 | CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> )=CH <sub>2</sub>             | CH <sub>3</sub>                 |
| A-78 | CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> )=CH <sub>2</sub>             | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |
| A-79 | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>                              | H                               |
| A-80 | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>                              | CH <sub>3</sub>                 |
| A-81 | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>                              | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |
| A-82 | CH(CH <sub>3</sub> )CH=CH <sub>2</sub>                          | H                               |
| A-83 | CH(CH <sub>3</sub> )CH=CH <sub>2</sub>                          | CH <sub>3</sub>                 |
| A-84 | CH(CH <sub>3</sub> )CH=CH <sub>2</sub>                          | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |
| A-85 | CH(CH <sub>3</sub> )C(CH <sub>3</sub> )=CH <sub>2</sub>         | H                               |
| A-86 | CH(CH <sub>3</sub> )C(CH <sub>3</sub> )=CH <sub>2</sub>         | CH <sub>3</sub>                 |
| A-87 | CH(CH <sub>3</sub> )C(CH <sub>3</sub> )=CH <sub>2</sub>         | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |
| A-88 | CH <sub>2</sub> -C≡CH                                           | H                               |
| A-89 | CH <sub>2</sub> -C≡CH                                           | CH <sub>3</sub>                 |
| A-90 | CH <sub>2</sub> -C≡CH                                           | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |

| Nr.   | R <sup>1</sup>                                                                                   | R <sup>2</sup>                  |
|-------|--------------------------------------------------------------------------------------------------|---------------------------------|
| A-91  | Cyclopentyl                                                                                      | H                               |
| A-92  | Cyclopentyl                                                                                      | CH <sub>3</sub>                 |
| A-93  | Cyclopentyl                                                                                      | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |
| A-94  | Cyclohexyl                                                                                       | H                               |
| A-95  | Cyclohexyl                                                                                       | CH <sub>3</sub>                 |
| A-96  | Cyclohexyl                                                                                       | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |
| A-97  | CH <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                                                   | H                               |
| A-98  | CH <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                                                   | CH <sub>3</sub>                 |
| A-99  | CH <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                                                   | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |
| A-100 | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH=CHCH <sub>2</sub> -                                          |                                 |
| A-101 | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> )=CHCH <sub>2</sub> -                         |                                 |
| A-102 | -CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> -CH=CHCH <sub>2</sub> -                                     |                                 |
| A-103 | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> )(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -           |                                 |
| A-104 | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> CHFCH <sub>2</sub> -                                            |                                 |
| A-105 | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CHF(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -                            |                                 |
| A-106 | -CH <sub>2</sub> CHF(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -                                            |                                 |
| A-107 | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH(CF <sub>3</sub> )(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -           |                                 |
| A-108 | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -                              |                                 |
| A-109 | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> S(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -                              |                                 |
| A-110 | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -                                                               |                                 |
| A-111 | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -                                                               |                                 |
| A-112 | -CH <sub>2</sub> CH=CHCH <sub>2</sub> -                                                          |                                 |
| A-113 | -CH(CH <sub>3</sub> )(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -                                           |                                 |
| A-114 | -CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> )(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -                           |                                 |
| A-115 | -CH(CH <sub>3</sub> )-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-                     |                                 |
| A-116 | -CH(CH <sub>3</sub> )-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -                                          |                                 |
| A-117 | -CH <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -                         |                                 |
| A-118 | -(CH <sub>2</sub> )-CH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> - |                                 |
| A-119 | -CH(CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> )-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -                          |                                 |
| A-120 | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CHOH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -                         |                                 |
| A-121 | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -                                                               |                                 |
| A-122 | -CH(CH <sub>3</sub> )-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -                                          |                                 |
| A-123 | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -N(CH <sub>3</sub> )-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -          |                                 |
| A-124 | -N=CH-CH=CH-                                                                                     |                                 |
| A-125 | -N=C(CH <sub>3</sub> )-CH=C(CH <sub>3</sub> )-                                                   |                                 |
| A-126 | -N=C(CF <sub>3</sub> )-CH=C(CF <sub>3</sub> )-                                                   |                                 |

- Die Verbindungen I eignen sich als Fungizide. Sie zeichnen sich aus durch eine hervorragende Wirksamkeit gegen ein breites Spektrum von pflanzenpathogenen Pilzen, insbesondere aus der Klasse der *Ascomyceten*, *Deuteromyceten*, *Oomyceten* und *Basidiomyceten*. Sie sind zum Teil systemisch wirksam und können im Pflanzenschutz als
- 5 Blatt- und Bodenfungizide eingesetzt werden.

- Besondere Bedeutung haben sie für die Bekämpfung einer Vielzahl von Pilzen an verschiedenen Kulturpflanzen wie Weizen, Roggen, Gerste, Hafer, Reis, Mais, Gras, Bananen, Baumwolle, Soja, Kaffee, Zuckerrohr, Wein, Obst- und Zierpflanzen und Gemüse-
- 10 sepflanzen wie Gurken, Bohnen, Tomaten, Kartoffeln und Kürbisgewächsen, sowie an den Samen dieser Pflanzen.

Speziell eignen sie sich zur Bekämpfung folgender Pflanzenkrankheiten:

- *Alternaria*-Arten an Gemüse und Obst,
- 15 • *Bipolaris*- und *Drechslera*-Arten an Getreide, Reis und Rasen,
- *Blumeria graminis* (echter Mehltau) an Getreide,
- *Botrytis cinerea* (Grauschimmel) an Erdbeeren, Gemüse, Zierpflanzen und Reben,
- *Erysiphe cichoracearum* und *Sphaerotheca fuliginea* an Kürbisgewächsen,
- *Fusarium*- und *Verticillium*-Arten an verschiedenen Pflanzen,
- 20 • *Mycosphaerella*-Arten an Getreide, Bananen und Erdnüssen,
- *Phytophthora infestans* an Kartoffeln und Tomaten,
- *Plasmopara viticola* an Reben,
- *Podosphaera leucotricha* an Äpfeln,
- *Pseudocercospora herpotrichoides* an Weizen und Gerste,
- 25 • *Pseudoperonospora*-Arten an Hopfen und Gurken,
- *Puccinia*-Arten an Getreide,
- *Pyricularia oryzae* an Reis,
- *Rhizoctonia*-Arten an Baumwolle, Reis und Rasen,
- *Septoria tritici* und *Stagonospora nodorum* an Weizen,
- 30 • *Uncinula necator* an Reben,
- *Ustilago*-Arten an Getreide und Zuckerrohr, sowie
- *Venturia*-Arten (Schorf) an Äpfeln und Birnen.

- Die Verbindungen I eignen sich außerdem zur Bekämpfung von Schadpilzen wie *Paecilomyces variotii* im Materialschutz (z.B. Holz, Papier, Dispersionen für den Anstrich, Fasern bzw. Gewebe) und im Vorratsschutz.
- 35

Die Verbindungen I werden angewendet, indem man die Pilze oder die vor Pilzbefall zu schützenden Pflanzen, Saatgüter, Materialien oder den Erdboden mit einer fungizid

wirksamen Menge der Wirkstoffe behandelt. Die Anwendung kann sowohl vor als auch nach der Infektion der Materialien, Pflanzen oder Samen durch die Pilze erfolgen.

- 5 Die fungiziden Mittel enthalten im allgemeinen zwischen 0,1 und 95, vorzugsweise zwischen 0,5 und 90 Gew.-% Wirkstoff.

Die Aufwandmengen liegen bei der Anwendung im Pflanzenschutz je nach Art des gewünschten Effektes zwischen 0,01 und 2,0 kg Wirkstoff pro ha.

- 10 Bei der Saatgutbehandlung werden im allgemeinen Wirkstoffmengen von 1 bis 1000 g/100 kg Saatgut, vorzugsweise 1 bis 200 g/100 kg, insbesondere 5 bis 100 g/100 kg verwendet.

- 15 Bei der Anwendung im Material- bzw. Vorratsschutz richtet sich die Aufwandmenge an Wirkstoff nach der Art des Einsatzgebietes und des gewünschten Effekts. Übliche Aufwandmengen sind im Materialschutz beispielsweise 0,001 g bis 2 kg, vorzugsweise 0,005 g bis 1 kg Wirkstoff pro Kubikmeter behandelten Materials.

- 20 Die Verbindungen I können in die üblichen Formulierungen überführt werden, z.B. Lösungen, Emulsionen, Suspensionen, Stäube, Pulver, Pasten und Granulate. Die Anwendungsform richtet sich nach dem jeweiligen Verwendungszweck; sie soll in jedem Fall eine feine und gleichmäßige Verteilung der erfindungsgemäßen Verbindung gewährleisten.

- 25 Die Formulierungen werden in bekannter Weise hergestellt, z.B. durch Verstrecken des Wirkstoffs mit Lösungsmitteln und/oder Trägerstoffen, gewünschtenfalls unter Verwendung von Emulgiermitteln und Dispergiermitteln. Als Lösungsmittel / Hilfsstoffe kommen dafür im wesentlichen in Betracht:

- 30 - Wasser, aromatische Lösungsmittel (z.B. Solvesso Produkte, Xylol), Paraffine (z.B. Erdölfraktionen), Alkohole (z.B. Methanol, Butanol, Pentanol, Benzylalkohol), Ketone (z.B. Cyclohexanon, gamma-Butyrolacton), Pyrrolidone (NMP, NOP), Acetate (Glykoldiacetat), Glykole, Dimethylfettsäureamide, Fettsäuren und Fettsäureester. Grundsätzlich können auch Lösungsmittelgemische verwendet werden,
- 35 - Trägerstoffe wie natürliche Gesteinsmehle (z.B. Kaoline, Tonerden, Talkum, Kreide) und synthetische Gesteinsmehle (z.B. hochdisperse Kieselsäure, Silikate); Emulgiermittel wie nichtionogene und anionische Emulgatoren (z.B. Polyoxyethylen-Fettalkohol-Ether, Alkylsulfonate und Arylsulfonate) und Dispergiermittel wie Lignin-Sulfitablaugen und Methylcellulose.

Als oberflächenaktive Stoffe kommen Alkali-, Erdalkali-, Ammoniumsalze von Ligninsulfonsäure, Naphthalinsulfonsäure, Phenolsulfonsäure, Dibutyl-naphthalinsulfonsäure, Alkylarylsulfonate, Alkylsulfate, Alkylsulfonate, Fettalkoholsulfate, Fettsäuren und sulfatierte Fettalkoholglykolether zum Einsatz, ferner Kondensationsprodukte von sulfoniertem Naphthalin und Naphthalinderivaten mit Formaldehyd, Kondensationsprodukte des Naphthalins bzw. der Naphthalinsulfonsäure mit Phenol und Formaldehyd, Polyoxyethylenoctylphenoether, ethoxyliertes Isooctylphenol, Octylphenol, Nonylphenol, Alkylphenolpolyglykolether, Tributylphenylpolyglykolether, Tristerylphenylpolyglykolether, Alkylarylpolyetheralkohole, Alkohol- und Fettalkoholethylenoxid-Kondensate, ethoxyliertes Rizinusöl, Polyoxyethylenalkylether, ethoxyliertes Polyoxypropylen, Laurylalkoholpolyglykoletheracetal, Sorbitester, Ligninsulfitaugen und Methylcellulose in Betracht.

Zur Herstellung von direkt versprühbaren Lösungen, Emulsionen, Pasten oder Öldispersionen kommen Mineralölfractionen von mittlerem bis hohem Siedepunkt, wie Kerosin oder Dieselöl, ferner Kohlenteeröle sowie Öle pflanzlichen oder tierischen Ursprungs, aliphatische, cyclische und aromatische Kohlenwasserstoffe, z.B. Toluol, Xylol, Paraffin, Tetrahydronaphthalin, alkylierte Naphthaline oder deren Derivate, Methanol, Ethanol, Propanol, Butanol, Cyclohexanol, Cyclohexanon, Isophoron, stark polare Lösungsmittel, z.B. Dimethylsulfoxid, N-Methylpyrrolidon oder Wasser in Betracht.

Pulver-, Streu- und Stäubemittel können durch Mischen oder gemeinsames Vermahlen der wirksamen Substanzen mit einem festen Trägerstoff hergestellt werden.

Granulate, z.B. Umhüllungs-, Imprägnierungs- und Homogengranulate, können durch Bindung der Wirkstoffe an feste Trägerstoffe hergestellt werden. Feste Trägerstoffe sind z.B. Mineralerden, wie Kieselgele, Silikate, Talkum, Kaolin, Attaclay, Kalkstein, Kalk, Kreide, Bolus, Löß, Ton, Dolomit, Diatomeenerde, Calcium- und Magnesiumsulfat, Magnesiumoxid, gemahlene Kunststoffe, Düngemittel, wie z.B. Ammoniumsulfat, Ammoniumphosphat, Ammoniumnitrat, Harnstoffe und pflanzliche Produkte, wie Getreidemehl, Baumrinden-, Holz- und Nußschalenmehl, Cellulosepulver und andere feste Trägerstoffe.

Die Formulierungen enthalten im allgemeinen zwischen 0,01 und 95 Gew.-%, vorzugsweise zwischen 0,1 und 90 Gew.-% des Wirkstoffs. Die Wirkstoffe werden dabei in einer Reinheit von 90% bis 100%, vorzugsweise 95% bis 100% (nach NMR-Spektrum) eingesetzt.

Beispiele für Formulierungen sind: 1. Produkte zur Verdünnung in Wasser

**A Wasserlösliche Konzentrate (SL)**

10 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden in Wasser oder einem  
5 wasserlöslichen Lösungsmittel gelöst. Alternativ werden Netzmittel oder andere Hilfsmittel zugefügt. Bei der Verdünnung in Wasser löst sich der Wirkstoff.

**B Dispergierbare Konzentrate (DC)**

20 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden in Cyclohexanon unter  
10 Zusatz eines Dispergiemittels z.B. Polyvinylpyrrolidon gelöst. Bei Verdünnung in Wasser ergibt sich eine Dispersion.

**C Emulgierbare Konzentrate (EC)**

15 15 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden in Xylol unter Zusatz von Ca-Dodecylbenzolsulfonat und Ricinusölethoxylat (jeweils 5 %) gelöst. Bei der Verdünnung in Wasser ergibt sich eine Emulsion.

**D Emulsionen (EW, EO)**

20 40 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden in Xylol unter Zusatz von Ca-Dodecylbenzolsulfonat und Ricinusölethoxylat (jeweils 5 %) gelöst. Diese Mischung wird mittels einer Emulgiermaschine (Ultraturax) in Wasser eingebracht und zu einer homogenen Emulsion gebracht. Bei der Verdünnung in Wasser ergibt sich eine Emulsion.

25 **E Suspensionen (SC, OD)**

20 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden unter Zusatz von Dispergier- und Netzmitteln und Wasser oder einem organischen Lösungsmittel in einer Rührwerkskugelmühle zu einer feinen Wirkstoffsuspension zerkleinert. Bei der Verdünnung in Wasser ergibt sich eine stabile Suspension des Wirkstoffs.

30

**F Wasserdispergierbare und wasserlösliche Granulate (WG, SG)**

50 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden unter Zusatz von Dispergier- und Netzmitteln fein gemahlen und mittels technischer Geräte (z.B. Extrusion, Sprühturm, Wirbelschicht) als wasserdispergierbare oder wasserlösliche Granulate  
35 hergestellt. Bei der Verdünnung in Wasser ergibt sich eine stabile Dispersion oder Lösung des Wirkstoffs.

**G Wasserdispergierbare und wasserlösliche Pulver (WP, SP)**

40 75 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden unter Zusatz von Dispergier- und Netzmitteln sowie Kieselsäuregel in einer Rotor-Strator Mühle vermahlen. Bei

der Verdünnung in Wasser ergibt sich eine stabile Dispersion oder Lösung des Wirkstoffs.

## 2. Produkte für die Direktapplikation

5

### H      Stäube (DP)

5 Gew.Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden fein gemahlen und mit 95 % feinteiligem Kaolin innig vermischt. Man erhält dadurch ein Stäubemittel.

10

### I      Granulate (GR, FG, GG, MG)

0.5 Gew-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden fein gemahlen und mit 95.5 % Trägerstoffe verbunden. Gängige Verfahren sind dabei die Extrusion, die Sprühtrocknung oder die Wirbelschicht. Man erhält dadurch ein Granulat für die Direktapplikation.

15

### J      ULV- Lösungen (UL)

10 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden in einem organischen Lösungsmittel z.B. Xylol gelöst. Dadurch erhält man ein Produkt für die Direktapplikation.

20

Die Wirkstoffe können als solche, in Form ihrer Formulierungen oder den daraus bereiteten Anwendungsformen, z.B. in Form von direkt versprühbaren Lösungen, Pulvern, Suspensionen oder Dispersionen, Emulsionen, Öldispersionen, Pasten, Stäubemitteln, Streumitteln, Granulaten durch Versprühen, Vernebeln, Verstäuben, Verstreuen oder Gießen angewendet werden. Die Anwendungsformen richten sich ganz nach den Verwendungszwecken; sie sollten in jedem Fall möglichst die feinste Verteilung der erfindungsgemäßen Wirkstoffe gewährleisten.

25

30

Wässrige Anwendungsformen können aus Emulsionskonzentraten, Pasten oder netzbaren Pulvern (Spritzpulver, Öldispersionen) durch Zusatz von Wasser bereit werden. Zur Herstellung von Emulsionen, Pasten oder Öldispersionen können die Substanzen als solche oder in einem Öl oder Lösungsmittel gelöst, mittels Netz-, Haft-, Dispergier- oder Emulgiermittel in Wasser homogenisiert werden. Es können aber auch aus wirksamer Substanz Netz-, Haft-, Dispergier- oder Emulgiermittel und eventuell Lösungsmittel oder Öl bestehende Konzentrate hergestellt werden, die zur Verdünnung mit Wasser geeignet sind.

35

40

Die Wirkstoffkonzentrationen in den anwendungsfertigen Zubereitungen können in größeren Bereichen variiert werden. Im allgemeinen liegen sie zwischen 0,0001 und 10%, vorzugsweise zwischen 0,01 und 1%.

Die Wirkstoffe können auch mit gutem Erfolg im Ultra-Low-Volume-Verfahren (ULV) verwendet werden, wobei es möglich ist, Formulierungen mit mehr als 95 Gew.-% Wirkstoff oder sogar den Wirkstoff ohne Zusätze auszubringen.

5

Zu den Wirkstoffen können Öle verschiedenen Typs, Netzmittel, Adjuvants, Herbizide, Fungizide, andere Schädlingsbekämpfungsmittel, Bakterizide, gegebenenfalls auch erst unmittelbar vor der Anwendung (Tankmix), zugesetzt werden. Diese Mittel können zu den erfindungsgemäßen Mitteln im Gewichtsverhältnis 1:10 bis 10:1 zugemischt

10

werden.

Die erfindungsgemäßen Mittel können in der Anwendungsform als Fungizide auch zusammen mit anderen Wirkstoffen vorliegen, der z.B. mit Herbiziden, Insektiziden, Wachstumsregulatoren, Fungiziden oder auch mit Düngemitteln. Beim Vermischen der Verbindungen I bzw. der sie enthaltenden Mittel in der Anwendungsform als Fungizide mit anderen Fungiziden erhält man in vielen Fällen eine Vergrößerung des fungiziden Wirkungsspektrums.

15

Die folgende Liste von Fungiziden, mit denen die erfindungsgemäßen Verbindungen gemeinsam angewendet werden können, soll die Kombinationsmöglichkeiten erläutern, nicht aber einschränken:

20

- Acylalanine wie Benalaxyl, Metalaxyl, Ofurace, Oxadixyl,
- Aminderivate wie Aldimorph, Dodine, Dodemorph, Fenpropimorph, Fenpropidin,
- 25     Guazatine, Iminoctadine, Spiroxamin, Tridemorph
- Anilinopyrimidine wie Pyrimethanil, Mepanipyrim oder Cyrodinyl,
- Antibiotika wie Cycloheximid, Griseofulvin, Kasugamycin, Natamycin, Polyoxin oder Streptomycin,
- Azole wie Bitertanol, Bromoconazol, Cyproconazol, Difenoconazole, Dinitroconazol,
- 30     Enilconazol, Epoxiconazol, Fenbuconazol, Fluquiconazol, Flusilazol, Flutriafol, Hexaconazol, Imazalil, Metconazol, Myclobutanil, Penconazol, Propiconazol, Prochloraz, Prothioconazol, Tebuconazol, Triadimefon, Triadimenol, Triflumizol, Triticonazol,
- Dicarboximide wie Iprodion, Myclozolin, Procymidon, Vinclozolin,
- 35     Dithiocarbamate wie Ferbam, Nabam, Maneb, Mancozeb, Metam, Metiram, Propinab, Polycarbamat, Thiram, Ziram, Zineb,
- Heterocyclische Verbindungen wie Anilazin, Benomyl, Boscalid, Carbendazim, Carboxin, Oxycarboxin, Cyazofamid, Dazomet, Dithianon, Famoxadon, Fenamidon, Fenarimol, Fuberidazol, Flutolanil, Furametpyr, Isoprothiolan, Mepronil, Nuarimol,

- Probenazol, Proquinazid, Pyrifenox, Pyroquilon, Quinoxifen, Silthiofam, Thiabendazol, Thifluzamid, Thiophanat-methyl, Tiadinil, Tricyclazol, Triforine,
- Kupferfungizide wie Bordeaux Brühe, Kupferacetat, Kupferoxychlorid, basisches Kupfersulfat,
- 5    • Nitrophenylderivate, wie Binapacryl, Dinocap, Dinobuton, Nitrophthal-isopropyl
- Phenylpyrrole wie Fenpiclonil oder Fludioxonil,
  - Schwefel
  - Sonstige Fungizide wie Acibenzolar-S-methyl, Benthiavalicarb, Carpropamid, Chlorothalonil, Cyflufenamid, Cymoxanil, Dazomet, Diclomezin, Diclocymet, Diethofencarb, Edifenphos, Ethaboxam, Fenhexamid, Fentin-Acetate, Fenoxanil, Ferimzone,

10    Fluazinam, Fosetyl, Fosetyl-Aluminium, Iprovalicarb, Hexachlorbenzol, Metrafenon, Pencycuron, Propamocarb, Phthalid, Toloclofos-methyl, Quintozene, Zoxamid

    - Strobilurine wie Azoxystrobin, Dimoxystrobin, Fluoxastrobin, Kresoxim-methyl, Metominostrobin, Orysastrobin, Picoxystrobin, Pyraclostrobin oder Trifloxystrobin,

15    • Sulfensäurederivate wie Captafol, Captan, Dichlofluanid, Folpet, Tolyfluanid

    - Zimtsäureamide und Analoge wie Dimethomorph, Flumetover oder Flumorph.

#### Synthesebeispiele

- 20    Die in den nachstehenden Synthesebeispielen wiedergegebenen Vorschriften wurden unter entsprechender Abwandlung der Ausgangsverbindungen zur Gewinnung weiterer Verbindungen I benutzt. Die so erhaltenen Verbindungen sind in der anschließenden Tabelle mit physikalischen Daten aufgeführt.

- 25    Beispiel 1 – Herstellung von 5-Chlor-6-(2,6-difluor-4-aminocarbonylphenyl)-7-(4-methylpiperidin-1-yl)-[1,2,4]-triazolo[1,5-a]primidin

- 30    Durch eine Lösung von 1,5 mmol 5-Chlor-6-(2,6-difluor-4-cyanophenyl)-7-(4-methylpiperidin-1-yl)-[1,2,4]-triazolo[1,5-a]primidin [vgl. WO 03/80615] in 20 ml Methanol wurde bis zur Sättigung HCl-Gas eingeleitet. Nach 24 Std. rühren bei etwa 20-25°C wurde der entstandene Niederschlag abfiltriert und in Dichlormethan aufgelöst. Nach Waschen mit Wasser und Trocknung wurde das Lösungsmittel entfernt. Nach Chromatographie an Kieselgel wurden 140 mg der Titelverbindung vom Fp. 197°C und 200 mg des entsprechenden Methylesters vom Fp. 176°C erhalten.

- 35    Beispiel 2 – Herstellung von 5-Methyl-6-(2,6-difluor-4-aminocarbonylphenyl)-7-(4-methylpiperidiny)-1,2,4-triazolo[1,5a]pyrimidin

- 40    Stufe 2a: 5-(Dimethylmalon-2-yl)-6-(2,6-difluor-4-cyanophenyl)-7-(4-methylpiperidiny)-1,2,4-triazolo[1,5a]pyrimidin

Eine Lösung von 1 g (2,7 mmol) 5-Chlor-6-(2,6-difluor,4-cyanophenyl)-7-(4-methylpiperidiny)-1,2,4-triazolo[1,5a]pyrimidin [vgl. WO 03/80615] und 1 g Natriumdimethylmalonat (6,5 mmol) in 10 ml Acetonitril wurden 4 Stunden bei 70-80°C und 2,5  
5 Tage bei 20-25°C gerührt. Dabei fiel ein gelber Festkörper aus. Man filtrierte die Reaktionsmischung über Kieselgur ab und rührte den Niederschlag mit einer Mischung aus verd. Salzsäure und Methylenchlorid bis zur Entfärbung. Nach Phasentrennung extrahierte man die wässrige Phase mit Methylenchlorid. Nach Trocknung der vereinigten organischen Phasen und Abdestillieren des Lösungsmittels blieb 1 g der Titelverbin-  
10 dung zurück.

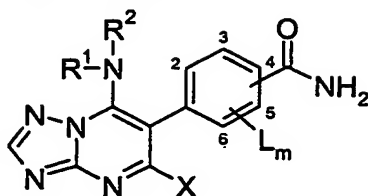
<sup>1</sup>H-NMR (CDCl<sub>3</sub>, δ in ppm): 8,4 (s, 1H); 7,4 (d, 2H); 4,65 (s, 1H); 3,7 /s, 6H); 3,55 (d, breit, 2H); 3,8 (t, breiet, 2H); 1,65 (d, breit, 2H); 1,55 (m, 1H); 1,3 (m, 2H); 0,95 (d, 3H).

15 Stufe 2b: 5-Methyl-6-(2,6-difluor,4-aminocarbonylphenyl)-7-(4-methylpiperidiny)-1,2,4-triazolo[1,5a]pyrimidin

Eine Lösung von 0,5 g (1,03 mmol) 5-(Dimethylmalon-2-yl)-6-(2,6-difluor,4-cyanophenyl)-7-(4-methylpiperidiny)-1,2,4-triazolo[1,5a]pyrimidin und 0,3 g (3,8 mmol)  
20 50 %ige Natronlauge in 6 ml Methanol/Wasser (5:1) wurde 3 Std. refluxiert. Nach Verdünnen mit Methyl-t-butylether (MTBE) und verdünnter Salzsäure wurde die organische Phase abgetrennt und die wässrige Phase mit MTBE extrahiert. Die vereinigten organischen Phasen wurden getrocknet und vom Lösungsmittel befreit. Der Rückstand wurde mittels präparativer MPLC über Kieselgel RP-18 mit Acetonitril/Wasser-  
25 Gemischen gereinigt. Aus dem Eluat blieben nach Abtrennung des Lösungsmittels 0,11 g der Titelverbindung als gelbes Harz zurück.

<sup>1</sup>H-NMR (CDCl<sub>3</sub>, δ in ppm): 8,35 (s, 1H); 7,8 (d, 2H); 7,7 (s, breit, 1H); 6,75 (s, breit, 1H); 3,65 (d, 2H); 2,8 (t, 2H); 2,35 (s, 3H); 1,6 (d, 2H); 1,5 (m, 1H); 1,3 (m, 2H); 0,9 (d,  
30 3H).

Tabelle I – Verbindungen der Formel I



| Nr.  | R <sup>1</sup>                                                                           | R <sup>2</sup> | X               | L <sub>m</sub>                            | Position<br>CONH <sub>2</sub> | Phys. Daten (Fp [°C];<br><sup>1</sup> H-NMR δ [ppm]))                                                        |
|------|------------------------------------------------------------------------------------------|----------------|-----------------|-------------------------------------------|-------------------------------|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| I-1  | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - |                | Cl              | 2,6-F <sub>2</sub>                        | 4                             | 197                                                                                                          |
| I-2  | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - |                | CH <sub>3</sub> | 2,6-F <sub>2</sub>                        | 4                             | (Bsp. 2b)                                                                                                    |
| I-3  | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - |                | Cl              | 2-F                                       | 4                             | 8,4 (s); 7,7 (m);<br>7,4 (t); 0,95 (d)                                                                       |
| I-4  | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - |                | Cl              | 2,5-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>       | 4                             | 130                                                                                                          |
| I-5  | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - |                | Cl              | 2-CH <sub>3</sub>                         | 4                             | 162-164                                                                                                      |
| I-6  | (R)<br>CH(CH <sub>3</sub> )C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>                              | H              | Cl              | 2,5-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>       | 4                             | 240-241                                                                                                      |
| I-7  | (R)<br>CH(CH <sub>3</sub> )C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>                              | H              | Cl              | 2-CH <sub>3</sub>                         | 4                             | 184                                                                                                          |
| I-8  | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - |                | Cl              | 2-Cl,5-OCH <sub>3</sub>                   | 4                             | 190-191                                                                                                      |
| I-9  | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - |                | Cl              | 2,5-Cl <sub>2</sub>                       | 4                             | 198-199                                                                                                      |
| I-10 | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - |                | Cl              | 2-CH <sub>3</sub> ,5-F                    | 4                             | 215-216                                                                                                      |
| I-11 | (R)<br>CH(CH <sub>3</sub> )C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>                              | H              | Cl              | 2-CH <sub>3</sub> ,5-F                    | 4                             | 214-215                                                                                                      |
| I-12 | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - |                | Cl              | 2-CH <sub>3</sub> ,5-Cl                   | 4                             | 223-225                                                                                                      |
| I-13 | (R)<br>CH(CH <sub>3</sub> )C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>                              | H              | Cl              | 2-CH <sub>3</sub> ,<br>5-OCH <sub>3</sub> | 4                             | 2 Atropisomere:<br>8,45; 8,4 (2s, 1H);<br>8,3; 8,35 (2s, 1H);<br>7,25; 7,1 (2s, 1H);<br>1,1; 1,0 (2d, 3H)    |
| I-14 | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - |                | Cl              | 2-Cl                                      | 4                             | 247-249                                                                                                      |
| I-15 | (R)<br>CH(CH <sub>3</sub> )C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>                              | H              | Cl              | 2-Cl                                      | 4                             | 2 Atropisomere:<br>8,35 (s, 1H); 8,15 (d,<br>1H); 7,95 (m, 1H);<br>7,55; 7,5 (2d, 1H);<br>1,05; 0,9 (2d, 3H) |
| I-16 | (R)<br>CH(CH <sub>3</sub> )C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>                              | H              | Cl              | 2-CH <sub>3</sub> ,5-Cl                   | 4                             | 2 Atropisomere:<br>8,35 (s, 1H); 7,95; 7,9<br>(2s, 1H); 7,4; 7,35<br>(2s, 1H); 1,0 (d, 3H)                   |

| Nr.  | R <sup>1</sup>                                                                           | R <sup>2</sup> | X  | L <sub>m</sub>                            | Position<br>CONH <sub>2</sub> | Phys. Daten (Fp [°C];<br><sup>1</sup> H-NMR δ [ppm])                                                               |
|------|------------------------------------------------------------------------------------------|----------------|----|-------------------------------------------|-------------------------------|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| I-17 | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - |                | Cl | 2-Cl,5-CH <sub>3</sub>                    | 4                             | 205-208                                                                                                            |
| I-18 | (R)<br>CH(CH <sub>3</sub> )C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>                              | H              | Cl | 2-Cl,5-CH <sub>3</sub>                    | 4                             | > 250                                                                                                              |
| I-19 | (R)<br>CH(CH <sub>3</sub> )C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>                              | H              | Cl | 2-CH <sub>3</sub>                         | 5                             | > 250                                                                                                              |
| I-20 | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - |                | Cl | 2-Cl                                      | 5                             | 8,3 (s); 8,0 (s);<br>7,9 (d); 7,5 (d); 0,9 (d)                                                                     |
| I-21 | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - |                | Cl | 2-CH <sub>3</sub>                         | 5                             | 223                                                                                                                |
| I-22 | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - |                | Cl | 2-CH <sub>3</sub> ,<br>4-OCH <sub>3</sub> | 5                             | 246-247                                                                                                            |
| I-23 | (R)<br>CH(CH <sub>3</sub> )C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>                              | H              | Cl | 2-Cl                                      | 5                             | 2 Atropisomere: 8,4;<br>8,3 (2s, 1H); 8,2 (2s,<br>1H); 8,1; 8,03 (2d,<br>1H); 7,65 (d, 1H);<br>1,05; 0,95 (2d, 3H) |
| I-24 | (R)<br>CH(CH <sub>3</sub> )C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>                              | H              | Cl | 2-CH <sub>3</sub> ,<br>4-OCH <sub>3</sub> | 5                             | Polares (HPLC) A-<br>trop-Isomer: 8,35 (s,<br>1H); 8,1 (s, 1H); 7,0<br>(s, 1H); 0,95 (d, 3H)                       |
| I-25 | (R)<br>CH(CH <sub>3</sub> )C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>                              | H              | Cl | 2-CH <sub>3</sub> ,<br>4-OCH <sub>3</sub> | 5                             | Unpolares (HPLC)<br>Atrop-Isomer: 8,35 (s,<br>1H); 8,15 (s, 1H); 7,0<br>(s, 1H); 0,95 (d, 3H)                      |

Beispiele für die Wirkung gegen Schadpilze

- 5 Die fungizide Wirkung der Verbindungen der Formel I ließ sich durch die folgenden Versuche zeigen:

- 10 Die Wirkstoffe wurden als eine Stammlösung aufbereitet mit 0,25 Gew.-% Wirkstoff in Aceton oder DMSO. Dieser Lösung wurde 1 Gew.-% Emulgator Uniperol® EL (Netzmittel mit Emulgier- und Dispergierwirkung auf der Basis ethoxylierter Alkylphenole) zugesetzt und entsprechend der gewünschten Konzentration mit Wasser verdünnt.

Anwendungsbeispiel 1 - Wirksamkeit gegen die Netzfleckenkrankheit der Gerste verursacht durch *Pyrenophora teres*

5 Blätter von in Töpfen gewachsenen Gerstenkeimlingen der Sorte „Hanna“ wurden mit wässriger Suspension in der unten angegebenen Wirkstoffkonzentration bis zur Tropfnässe besprüht. 24 Stunden nach dem Antrocknen des Spritzbelages wurden die Versuchspflanzen mit einer wässrigen Sporensuspension von *Pyrenophora* [syn. *Drechslera*] *teres*, dem Erreger der Netzfleckenkrankheit inokuliert. Anschließend wurden die Versuchspflanzen im Gewächshaus bei Temperaturen zwischen 20 und 24°C und 95  
10 bis 100 % relativer Luftfeuchtigkeit aufgestellt. Nach 6 Tagen wurde das Ausmaß der Krankheitsentwicklung visuell in % Befall der gesamten Blattfläche ermittelt.

15 In diesem Test zeigten die mit 63 ppm der Verbindungen I-1, bzw. I-25 behandelten Pflanzen nur etwa 3 % Befall, während die unbehandelten Pflanzen zu 90 % befallen waren.

Anwendungsbeispiel 2 - Wirksamkeit gegen Rebenperonospora verursacht durch *Plasmopara viticola*

20 Blätter von Topfreben der Sorte "Riesling" wurden mit wässriger Suspension in der unten angegebenen Wirkstoffkonzentration bis zur Tropfnässe besprüht. Am folgenden Tag wurden die Unterseiten der Blätter mit einer wässrigen Zoosporenaufschwemmung von *Plasmopara viticola* inokuliert. Danach wurden die Reben zunächst für 48 Stunden in einer wasserdampfgesättigten Kammer bei 24°C und anschließend für  
25 5 Tage im Gewächshaus bei Temperaturen zwischen 20 und 30°C aufgestellt. Nach dieser Zeit wurden die Pflanzen zur Beschleunigung des Sporangienträgerausbruchs abermals für 16 Stunden in eine feuchte Kammer gestellt. Dann wurde das Ausmaß der Befallsentwicklung auf den Blattunterseiten visuell ermittelt.

30 In diesem Test zeigten die mit 250 ppm der Titelverbindung aus Beispiel 1 behandelten Pflanzen keinen Befall, während die unbehandelten Pflanzen zu 90 % befallen waren.

Anwendungsbeispiel 3 - Wirksamkeit gegen den Grauschimmel an Paprikablättern verursacht durch *Botrytis cinerea* bei protektiver Anwendung

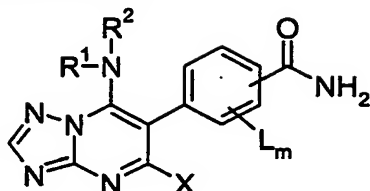
35 Paprikasämlinge der Sorte "Neusiedler Ideal Elite" wurden, nachdem sich 2 bis 3 Blätter gut entwickelt hatten, mit einer wässrigen Suspension in der unten angegebenen Wirkstoffkonzentration bis zur Tropfnässe besprüht. Am nächsten Tag wurden die behandelten Pflanzen mit einer Sporensuspension von *Botrytis cinerea*, die  $1,7 \times 10^6$   
40 Sporen/ml in einer 2 %igen wässrigen Biomalzlösung enthielt, inokuliert. Anschließend

wurden die Versuchspflanzen in eine Klimakammer mit 22 bis 24°C, Dunkelheit und hoher Luftfeuchtigkeit gestellt. Nach 5 Tagen konnte das Ausmaß des Pilzbefalls auf den Blättern visuell in % ermittelt werden.

- 5 In diesem Test zeigten die mit 63 ppm der Verbindungen I-2, I-14, I-23, I-24, bzw. I-25 behandelten Pflanzen nicht mehr als 30 % Befall, während die unbehandelten Pflanzen zu 75 % befallen waren.

# Patentansprüche

## 1. Triazolopyrimidine der Formel I



5 in der die Substituenten folgende Bedeutung haben:

10  $R^1, R^2$  unabhängig voneinander Wasserstoff,  $C_1$ - $C_8$ -Alkyl,  $C_1$ - $C_8$ -Halogenalkyl,  $C_3$ - $C_8$ -Cycloalkyl,  $C_3$ - $C_8$ -Halogenycycloalkyl,  $C_2$ - $C_8$ -Halogenalkenyl,  $C_3$ - $C_6$ -Cycloalkenyl,  $C_3$ - $C_6$ -Halogenycycloalkenyl,  $C_2$ - $C_8$ -Alkynyl,  $C_2$ - $C_8$ -Halogenalkynyl oder Phenyl, Naphthyl, oder ein fünf- oder sechsgliedriger gesättigter, partiell ungesättigter oder aromatischer Heterocyclus, enthaltend ein bis vier Heteroatome aus der Gruppe O, N oder S,

15  $R^1$  und  $R^2$  können auch zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, ein fünf- oder sechsgliedriges Heterocyclyl oder Heteroaryl bilden, welches über N gebunden ist und ein bis drei weitere Heteroatome aus der Gruppe O, N und S als Ringglied enthalten und/oder einen oder mehrere Substituenten aus der Gruppe Halogen,  $C_1$ - $C_6$ -Alkyl,  $C_1$ - $C_6$ -Halogenalkyl,  $C_2$ - $C_6$ -Alkenyl,  $C_2$ - $C_6$ -Halogenalkenyl,  $C_1$ - $C_6$ -Alkoxy,  $C_1$ - $C_6$ -Halogenalkoxy,  $C_3$ - $C_6$ -Alkenyloxy,  $C_3$ - $C_6$ -Halogenalkenyloxy, (exo)- $C_1$ - $C_6$ -Alkylen und Oxy- $C_1$ - $C_3$ -alkylenoxy tragen kann;

20  $R^1$  und/oder  $R^2$  können eine bis vier gleiche oder verschiedene Gruppen  $R^a$  tragen:

25  $R^a$  Halogen, Cyano, Nitro, Hydroxy,  $C_1$ - $C_6$ -Alkyl,  $C_1$ - $C_6$ -Halogenalkyl,  $C_1$ - $C_6$ -Alkylcarbonyl,  $C_3$ - $C_6$ -Cycloalkyl,  $C_1$ - $C_6$ -Alkoxy,  $C_1$ - $C_6$ -Halogenalkoxy,  $C_1$ - $C_6$ -Alkoxycarbonyl,  $C_1$ - $C_6$ -Alkylthio,  $C_1$ - $C_6$ -Alkylamino, Di- $C_1$ - $C_6$ -alkylamino,  $C_2$ - $C_8$ -Alkenyl,  $C_2$ - $C_8$ -Halogenalkenyl,  $C_3$ - $C_8$ -Cycloalkenyl,  $C_2$ - $C_8$ -Alkenyloxy,  $C_3$ - $C_6$ -Halogenalkenyloxy,  $C_2$ - $C_8$ -Alkynyl,  $C_2$ - $C_8$ -Halogenalkynyl,  $C_3$ - $C_6$ -Alkynyloxy,  $C_3$ - $C_6$ -Halogenalkinyloxy,  $C_3$ - $C_6$ -Cycloalkoxy,  $C_3$ - $C_6$ -Cycloalkenyloxy, Oxy- $C_1$ - $C_3$ -alkylenoxy, Phenyl, Naphthyl, fünf- bis zehngliedriger gesättigter, partiell ungesättigter oder aromatischer Heterocyclus, enthaltend ein bis vier Heteroatome aus der Gruppe O, N oder S,

30

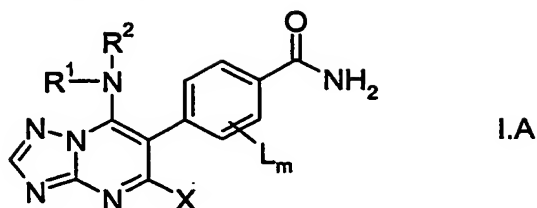
35

## 51

wobei diese aliphatischen, alicyclischen oder aromatischen Gruppen ihrerseits partiell oder vollständig halogeniert sein oder eine bis drei Gruppen  $R^b$  tragen können:

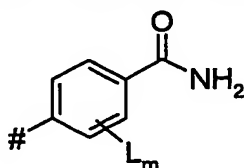
- 5  $R^b$  Halogen, Cyano, Nitro, Hydroxy, Mercapto, Amino, Carboxyl, Aminocarbonyl, Aminothiocarbonyl, Alkyl, Haloalkyl, Alkenyl, Alkenyloxy, Alkinyloxy, Alkoxy, Halogenalkoxy, Alkylthio, Alkylamino, Dialkylamino, Formyl, Alkylcarbonyl, Alkylsulfonyl, Alkylsulfoxyl, Alkoxycarbonyl, Alkylcarbonyloxy, Alkylaminocarbonyl, 10 Dialkylaminocarbonyl, Alkylaminothiocarbonyl, Dialkylaminothiocarbonyl, wobei die Alkylgruppen in diesen Resten 1 bis 6 Kohlenstoffatome enthalten und die genannten Alkenyl- oder Alkinylgruppen in diesen Resten 2 bis 8 Kohlenstoffatome enthalten;
- 15 und/oder einen bis drei der folgenden Reste:
- 20 Cycloalkyl, Cycloalkoxy, Heterocyclyl, Heterocyclyloxy, wobei die cyclischen Systeme 3 bis 10 Ringglieder enthalten; Aryl, Aryloxy, Arylthio, Aryl- $C_1$ - $C_6$ -alkoxy, Aryl- $C_1$ - $C_6$ -alkyl, Hetaryl, Hetaryloxy, Hetarylthio, wobei die Arylreste vorzugsweise 6 bis 10 Ringglieder, die Hetarylreste 5 oder 6 Ringglieder enthalten, wobei die cyclischen Systeme partiell oder vollständig halogeniert oder durch Alkyl- oder Haloalkylgruppen substituiert sein 25 können;
- L Halogen, Cyano,  $C_1$ - $C_6$ -Alkyl,  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkyl,  $C_1$ - $C_6$ -Alkoxy,  $C_3$ - $C_6$ -Alkenyloxy oder  $C_1$ - $C_4$ -Alkoxycarbonyl;
- 30 m 1, 2, 3 oder 4, wobei die Gruppen L verschieden sein können, wenn m größer als 1 ist;
- X Halogen, Cyano,  $C_1$ - $C_4$ -Alkyl,  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkyl,  $C_1$ - $C_4$ -Alkoxy oder  $C_1$ - $C_2$ -Halogenalkoxy.
- 35 2. Verbindungen der Formel I gemäß Anspruch 1, in der  $R^1$  nicht Wasserstoff bedeutet.

3. Verbindungen der Formel I.A:

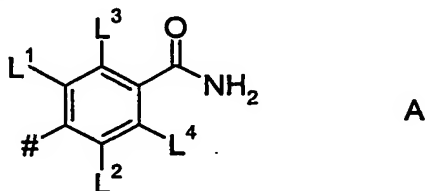


in der die Variablen gemäß Anspruch 1 definiert sind.

5 4. Verbindungen der Formel I.A gemäß Anspruch 3, in der die Phenylgruppe



der Gruppe A entspricht:



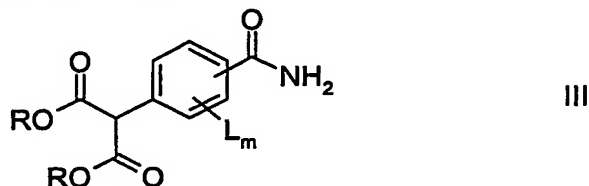
wobei

- 10  $L^1$  Halogen, Halogenmethyl oder  $C_1$ - $C_4$ -Alkyl;  
 $L^2, L^3, L^4$  Wasserstoff oder Halogen,  $C_1$ - $C_4$ -Alkyl,  $C_1$ - $C_2$ -Halogenalkyl oder  $C_1$ - $C_4$ -Alkoxy bedeuten.

- 15 5. Verfahren zur Herstellung der Verbindungen der Formel I gemäß Anspruch 1, in der X für Halogen, Cyano,  $C_1$ - $C_4$ -Alkyl,  $C_1$ - $C_4$ -Alkoxy oder  $C_1$ - $C_2$ -Halogenalkoxy steht, durch Umsetzung von 5-Aminotriazol der Formel II

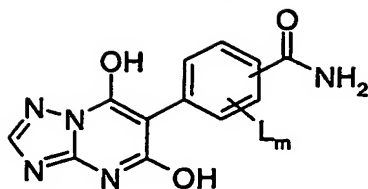


mit Phenymalonaten der Formel III,



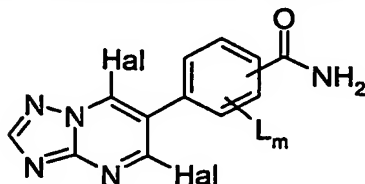
- 20 in der R für Alkyl steht, zu Dihydroxytriazolopyrimidinen der Formel IV,

53



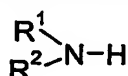
IV

Halogenierung zu den Dihalogenverbindungen der Formel V,



V

und Umsetzung von V mit Aminen der Formel VI



VI

5

zu Verbindungen der Formel I, in der X für Halogen steht, gewünschtenfalls zu Herstellung von Verbindungen I, in denen X für Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy oder C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-Halogenalkoxy steht, Umsetzung von Verbindungen I, in denen X Halogen bedeutet, mit Verbindungen der Formel VII,

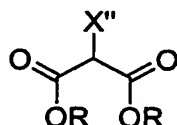
10

M-X'

VII

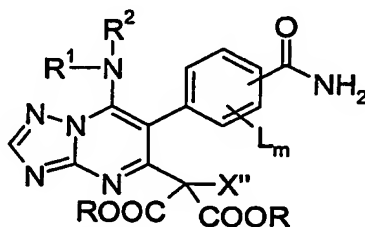
die, je nach der einzuführenden Gruppe X', ein anorganisches Cyanid, ein Alkoxyalat oder ein Halogenalkoxyalat darstellen und in der M für ein Ammonium-, Tetraalkylammonium-, Alkali- oder Erdalkalimetallkation steht und, gewünschtenfalls, zur Herstellung von Verbindungen der Formel I gemäß Anspruch 1, in der X für Alkyl steht, durch Umsetzung der Verbindungen I, in denen X für Halogen steht, mit Malonaten der Formel VIII,

15



VIII

in der X'' Wasserstoff oder C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-Alkyl und R C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl bedeuten, zu Verbindungen der Formel IX



IX

20

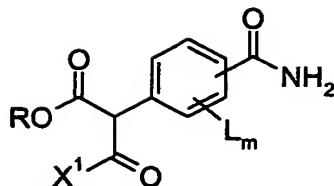
und Decarboxylierung zu Verbindungen I, in denen X für Alkyl steht.

6. Verfahren zur Herstellung der Verbindungen der Formel I gemäß Anspruch 1, in der X für C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl steht, durch Umsetzung von

25

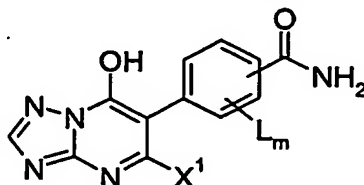
5-Aminotriazol der Formel II gemäß Anspruch 5 mit Ketoestern der Formel IIIa,

54



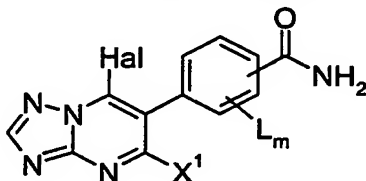
IIIa

in der X¹ für C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Halogenalkyl und R für C₁-C₄-Alkyl steht, zu 5-Alkyl-7-hydroxy-6-phenyltriazolopyrimidinen der Formel IVa



IVa

5 Halogenierung von IVa zu 7-Halogenotriazolopyrimidinen der Formel Va

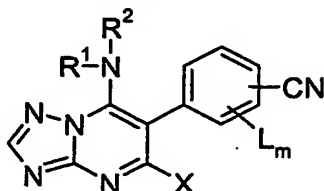


Va

und Umsetzung von Va mit Aminen der Formel VI gemäß Anspruch 5 zu Verbindungen I, in denen X für C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Halogenalkyl steht.

10 7. Verbindungen der Formeln IV, IVa, V und Va gemäß Ansprüchen 5 und 6.

8. Verfahren zur Herstellung von Verbindungen der Formel I gemäß Anspruch 1, durch Umsetzung von 6-Cyanophenyl-Triazolopyrimidinen der Formel XI



XI

15 in Anwesenheit von Schwefelsäure oder im Polyethylenglycol / NaOH -System oder mit Harnstoff / Wasserstoffperoxid.

9. Fungizides Mittel, enthaltend einen festen oder flüssigen Träger und eine Verbindung der Formel I gemäß Anspruch 1

20

10. Saatgut, enthaltend 1 bis 1000 g einer Verbindung der Formel I gemäß Anspruch 1 pro 100 kg.

25

11. Verfahren zur Bekämpfung von pflanzenpathogenen Schadpilzen, dadurch gekennzeichnet, dass man die Pilze, oder die vor Pilzbefall zu schützenden Materi-

alien, Pflanzen, den Boden oder Saatgüter mit einer wirksamen Menge einer Verbindung der Formel I gemäß Anspruch 1 behandelt.